This Page Is Inserted by IFW Operations and is not a part of the Official Record

BEST AVAILABLE IMAGES

Defective images within this document are accurate representations of the original documents submitted by the applicant.

Defects in the images may include (but are not limited to):

- BLACK BORDERS
- TEXT CUT OFF AT TOP, BOTTOM OR SIDES
- FADED TEXT
- ILLEGIBLE TEXT
- SKEWED/SLANTED IMAGES
- COLORED PHOTOS
- BLACK OR VERY BLACK AND WHITE DARK PHOTOS
- GRAY SCALE DOCUMENTS

IMAGES ARE BEST AVAILABLE COPY.

As rescanning documents will not correct images, please do not report the images to the Image Problems Mailbox.

THIS PAGE BLANK (USPTO)

Requested Patent:

EP0044807A2

Title:

N-PHENYLSULFONYL-N'-PYRIMIDINYLUREAS;

Abstracted Patent:

US4419121;

Publication Date:

1983-12-06 :

Inventor(s):

MEYER WILLY (CH); FOERY WERNER (CH);

Applicant(s):

CIBA GEIGY CORP (US) ;

Application Number:

US19830458584 19830117;

Priority Number(s):

CH19810003991 19810617; CH19800005481 19800717; CH19800008216 19801105 :

IPC Classification:

C07D239/42; A01N43/54;

Equivalents:

AU545208, BG60335, BG61518, BR8104617, BR8104618, BR8104619, CA1205482, CA1330438, CY1438, DD215461, DD220601, DE3160818D, DE3172974D, DE3173493D, DK144190, DK163664B, DK163664C, DK164901B, DK164901C, DK165182B, DK165182C, DK166082B, DK166082C, DK189391, DK2392, DK318681, EG15401, EP0044808, B1, EP0044809, B1, ES8304553, ES8401950, GR74308, IL63324, KR8500495, MX170994, MX170995, MX6981E, MY13887, MY58186, NZ197733, PH18233, RO83456, TR21355, US4425154, US4444583, US4476321, US4479821, US4510325, US4514212, US4537619, US4561878, US4629810, US4681619, ZW16681

ABSTRACT:

N-Phenylsulfonyl-N'-pyrimidinylureas of the general formula and the salts thereof with amines, alkali metal or alkaline earth metal bases or with quaternary ammonium bases, have good preand postemergence selective herbicidal and growth regulating properties. In the above formula A is a C1-C6 alkyl radical which is substituted by C1-C4alkoxy, C1-C4alkylthio, C1-C4alkylsulfinyl, or C1-C4alkylsulfonyl, X is oxygen, sulfur, a sulfinyl or sulfonyl bridge, Z is oxygen or sulfur, m is 1 or 2, R2 is hydrogen, halogen, C1-C5alkyl, C2-C5alkenyl, C1-C4haloalkyl, or a radical -Y-R5, -COOR6, -NO2 or -CO-NR7-R8, R3 and R4, each independently of the other, are hydrogen, C1-C4alkyl, C1-C4alkoxy, C1-C4alkylthio, C1-C4haloalkyl, halogen or alkoxyalkyl of at most 4 carbon atoms, R5 and R6, each independently of the other, are C1-C5alkyl, C2-C5alkenyl or C2-C6alkynyl, R7 and R8, each independently of the other, are hydrogen, C1-C5alkyl, C2-C5alkenyl or C2-C6alkynyl, and Y is oxygen, sulfur, a sulfinyl or sulfonyl bridge.



11) Veröffentlichungsnummer:

0 044 807

A2

12

ıŝ

EUROPÄISCHE PATENTANMELDUNG

(21) Anmeldenummer: 81810281.6

22 Anmeldetag: 13.07.81

(5) Int. Ci.³: A 01 N 47/36

C 07 D 251/16, C 07 D 251/22 C 07 D 251/46, C 07 D 239/42

C 07 D 239/46

//C07C143/78, C07C147/06, C07C147/14, C07C149/443

(30) Priorität: 17.07.80 CH 5481/80 05.11.80 CH 8216/80 17.06.81 CH 3991/81

- (43) Veröffentlichungstag der Anmeldung: 27.01.82 Patentblatt 82/4
- (84) Benannte Vertragsstaaten: AT BE DE FR GB IT NL SE

(1) Anmelder: CIBA-GEIGY AG Patentabteilung Postfach CH-4002 Basel(CH)

- 22 Erfinder: Meyer, Willy Talstrasse 49 CH-4125 Riehen(CH)
- (72) Erfinder: Föry, Werner, Dr. Benkenstrasse 65 CH-4054 Basel(CH)

N-Phenylsulfonyl-N'-pyrimidinyl- und -triazinylharnstoffe.

(57) N-Phenylsulfonyl-N'-diazinyl- und -triazinyl-harnstoffe der allgemeinen Formel I

und die Salze dieser Verbindungen mit Aminen, Alkali- oder Erdalkali-metallbasen oder mit quaternären Ammoniumbasen haben gute pre- und post-emergent-selektive herbizide und wuchsregulierende Eigenschaften:

In dieser Formel bedeuten

- einen durch C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Alkylthio, C₁-C₄-Alkylsulfinyl, C₁-C₄-Alkylsulfonyl, C₁-C₄-Halogenalkoxy, C₁-C₄-Halogenalkylthio, C₁-C₄-Halogenalkylsulfonyl substituierten C₁-C₆-Alkylrest oder einen gegebenenfalls durch die aufgezählten Substituenten substituierten C₂-C₆-Alkenylrest oder einen C₂-C₆-Halogenalkenylrest,
- E die Methingruppe oder Stickstoff,
- X Sauerstoff, Schwefel, eine Sulfinyl- oder Sulfonylbrücke,
- Z Sauerstoff oder Schwefel,
 - m die Zahl eins oder zwei

R₁ Wasserstoff, Halogen, C₁-C₅-Alkyl, C₂-C₅-Alkenyl oder einen Rest -Y-R₅,

R₂ Wasserstoff, Halogen, C₁-C₅-Alkyl, C₂-C₅-Alkenyl, C₁-C₄-Halogen-alkyl, oder einen Rest -Y-R₅, -COOR₆, -NO₂ oder -CO-NR₇R₈,

R₃ und R₄ unabhängig voneinander Wasserstoff, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Alkylthio, C₁-C₄-Halogenalkyl, Halogen oder Alkoxy-alkyl mit höchstens 4 Kohlenstoffatomen,

R₅ und R₆ je C₁-C₅-Alkyl, C₂-C₅-Alkenyl oder C₂-C₆-Alkinyl,

R₂ und R₈ unabhängig voneinander Wasserstoff, C₁-C₅-Alkyl, C₂-C₅-Alkenyl oder C₂-C₆-Alkinyl und

Y Sauerstoff, Schwefel, eine Sulfinyl- oder Sulfonylbrücke.

EP

CIBA-GEIGY AG
Basel (Schweiz)

5-12965/1+2/+/A

N-Phenylsulfonyl-N'-pyrimidinyl- und -triazinylharnstoffe

Die vorliegende Erfindung betrifft neue, herbizid wirksame und pflanzenwuchsregulierende N-Phenylsulfonyl-N'-pyrimidinyl- und -triazinyl-harnstoffe, Verfahren zu ihrer Herstellung, sie als Wirkstoffe enthaltende Mittel, sowie deren Verwendung zum Bekämpfen von Unkräutern, vor allem selektiv in Nutzpflanzenkulturen oder zum Regulieren und Hemmen des Pflanzenwachstums. Darüber hinaus betrifft die Erfindung auch als Zwischenprodukte hergestellte neue Phenylsulfonamide.

Die erfindungsgemässen N-Phenylsulfonyl-N'-pyrimidinyl- und -triazinylharnstoffe entsprechen der allgemeinen Formel I

worin

- A einen durch C_1 - C_4 -Alkoxy, C_1 - C_4 -Alkylthio, C_1 - C_4 -Alkylsulfinyl, C_1 - C_4 -Alkylsulfonyl, C_1 - C_4 -Halogenalkoxy, C_1 - C_4 -Halogenalkylthio, C_1 - C_4 -Halogenalkylsulfinyl oder C_1 - C_4 -Halogenalkylsulfonyl substituierten C_1 - C_6 -Alkylrest oder einen gegebenenfalls durch die aufgezählten Substituenten substituierten C_2 - C_6 -Alkenylrest oder einen C_2 - C_6 -Halogenalkenylrest,
- E die Methingruppe oder Stickstoff,
- X Sauerstoff, Schwefel, eine Sulfinyl- oder Sulfonylbrücke,
- Z Sauerstoff oder Schwefel,
- m die Zahl eins oder zwei
- R_1 Wasserstoff, Halogen, C_1 - C_5 -Alkyl, C_2 - C_5 -Alkenyl oder einen Rest -Y- R_5 ,

- R₂ Wasserstoff, Halogen, C₁-C₅-Alkyl, C₂-C₅-Alkenyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, oder einen Rest -Y-R₅, -COOR₆, -NO₂ oder -CO-NR₇R₈,
- R₃ und R₄ unabhängig voneinander Wasserstoff, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Alkylthio, C₁-C₄-Halogenalkyl, Halogen oder Alkoxy-alkyl mit höchstens 4 Kohlenstoffatomen,
- R_5 und R_6 je C_1 - C_5 -Alkyl, C_2 - C_5 -Alkenyl oder C_2 - C_6 -Alkinyl,
- R_7 und R_8 unabhängig voneinander Wasserstoff, C_1 - C_5 -Alkyl, C_2 - C_5 -Alkenyl oder C_2 - C_6 -Alkinyl und
- Y Sauerstoff, Schwefel, eine Sulfinyl- oder Sulfonylbrücke bedeuten, sowie den Salzen dieser Verbindungen.

Harnstoffverbindungen, Triazinverbindungen und Pyrimidinverbindungen mit herbizider Wirkung sind allgemein bekannt. Kürzlich wurden Arylsulfamoyl-heterocyclyl-aminocarbamoylverbindungen mit herbizider und pflanzenwuchsregulierender Wirkung, beispielsweise in den europäischen Patentpublikationen Nr. 1514, 1515, dem US Patent No. 4 127 405, in der DT-OS 2 715 786 oder in der FR-PS 1 468 747 beschrieben.

In den Definitionen ist unter Alkyl geradkettiges oder verzweigtes Alkyl zu verstehen; z.B.: Methyl, Aethyl, n-Propyl, i-Propyl, die vier isomeren Butyl, n-Amyl, i-Amyl, 2-Amyl, 3-Amyl, n-Hexyl oder i-Hexyl, vorzugsweise ist der Alkylrest jedoch geradkettig.

Unter Alkoxy ist zu verstehen: Methoxy, Aethoxy, n-Propyloxy, i-Propyloxy und die vier isomeren Butyloxyreste, insbesondere aber Methoxy oder Aethoxy.

Beispiele für Alkylthio sind Methylthio, Aethylthio, n-Propylthio, i-Propylthio und n-Butylthio, insbesondere aber Methylthio und Aethylthio.

Beispiele für Alkenylreste sind Vinyl, Allyl, Isopropenyl, 1-Propenyl, 1-Butenyl, 2-Butenyl, 3-Butenyl, 1-Isobutenyl, 2-Isobutenyl,

1-Pentenyl, 2-Pentenyl, 3-Pentenyl und 4-Pentenyl, insbesondere aber Vinyl, Allyl und 4-Pentenyl.

Beispiele für Alkylsulfinyl sind Methylsulfinyl, Aethylsulfinyl, n-Propylsulfinyl und n-Butylsulfinyl, insbesondere aber Methylsulfinyl und Aethylsulfinyl.

Beispiele für Alkylsulfonyl sind Methylsulfonyl, Aethylsulfonyl, n-Propylsulfonyl und n-Butylsulfonyl, insbesondere aber Methylsulfonyl und Aethylsulfonyl.

Unter Halogen in den Definitionen sowie in Halogenalkoxy,
-alkylsulfinyl, -alkylsulfonyl, -alkylthio und -alkenyl sind Fluor,
Chlor und Brom, vorzugsweise jedoch Fluor und Chlor zu verstehen.

Die Erfindung umfasst ebenfalls die Salze, die die Verbindungen der Formel I mit Aminen, Alkali- und Erdalkalimetallbasen oder quaternären Ammoniumbasen bilden können.

Unter Alkali- und Erdalkalimetallhydroxyden als Salzbildner sind die Hydroxyde von Lithium, Natrium, Kalium, Magnesium oder Calcium hervorzuheben, insbesondere aber die von Natrium oder Kalium.

Beispiele für zur Salzbildung geeignete Amine sind primäre, sekundäre und tertiäre aliphatische und aromatische Amine wie Methylamin, Aethylamin, Propylamin, i-Propylamin, die vier isomeren Butylamine, Dimethylamin, Diäthylamin, Diäthanolamin, Dipropylamin, Diisopropylamin, Di-n-butylamin, Pyrrolidin, Piperidin, Morpholin, Trimethylamin, Triäthylamin, Tripropylamin, Chinuclidin, Pyridin, Chinolin und i-Chinolin, insbesondere aber Aethyl-, Propyl-, Diäthyl- oder Triäthylamin, vor allem aber iso-Propylamin und Diäthanolamin.

Beispiele für quaternäre Ammoniumbasen sind im allgemeinen die Kationen von Halogenamminiumsalzen, z.B. das Tetramethylammoniumkation, das Trimethylbenzylammoniumkation, das Triäthylbenzylammonium-

. ...

kation, das Tetraäthylammoniumkation, das Trimethyläthylammoniumkation, aber auch das Ammoniumkation.

Unter den Verbindungen der Formel I sind diejenigen bevorzugt, in denen

- a) Z Sauerstoff bedeutet und
- b) die Reste R₃ und R₄ zusammen nicht mehr als 4 Kohlenstoffatome enthalten.

Die Gruppe a kann aufgeteilt werden in zwei weitere Untergruppen, die aus Verbindungen bestehen, in denen

- aa) m die Zahl eins und
- ab) m die Zahl zwei bedeutet.

Aus der Gruppe aa) sind die Verbindungen bevorzugt, in denen der Rest -X-A in der 2- oder 3-Position zum Sulfonylrest steht. Hier-unter geniessen eine weitere Bevorzugung die Verbindungen, in denen der Rest -X-A in der 2-Position steht.

Aus der Gruppe ab) bilden die Verbindungen eine bevorzugte Gruppe, in denen die beiden Reste -X-A in 2- und 5-Stellung zur Sulfonylgruppe stehen.

Eine weitere Bevorzugung von Verbindungen der oben aufgelisteten Untergruppen der Gruppen aa) und ab) besteht darin, dass die Reste R₃ und R₄ zusammen höchstens 4 Kohlenstoffatome enthalten. Es bestehen somit die besonders bevorzugten Gruppen von Verbindungen darin, dass in Verbindungen der Formel I

- aab) nur ein Rest -X-A in der 2-Stellung zum Sulfonylrest vorhanden ist, Z Sauerstoff bedeutet und die Reste R₃ und R₄ zusammen nicht mehr als 4 Kohlenstoffatome enthalten, und
- abb) zwei Reste -X-A in 2- und 5-Stellung zum Sulfonylrest vorhanden sind, Z Sauerstoff bedeutet und die Reste R₃ und R₄ zusammen nicht mehr als 4 Kohlenstoffatome enthalten.

Aus der Gruppe aab) sind die Verbindungen bevorzugt, in denen $\rm R_1$ Wasserstoff bedeutet, und der Rest $\rm R_2$ in der 5- oder 6-Stellung zur Sulfonylgruppe steht.

Von diesen Verbindunen sind wiederum die bevorzugt, in denen R_2 für Wasserstoff, Halogen, C_1 - C_4 -Alkoxy, Nitro oder COOR $_6$ steht.

Eine weitere Bevorzugung innerhalb der letztgenannten Gruppe geniessen die Verbindungen, in denen R_2 Wasserstoff, Fluor, Nitro oder C_1 - C_4 -Alkoxy und R_3 und R_4 jeweils Wasserstoff, C_1 - C_4 -Alkyl, C_1 - C_4 -Alkoxy, C_1 - C_4 -Alkylthio, Halogen oder Alkoxyalkyl bedeuten, wobei R_3 und R_4 zusammen höchstens 4 Kohlenstoffatome enthalten.

Unter diesen Verbindungen sind wiederum jene bevorzugt, in denen R_2 Wasserstoff und R_3 und R_4 jeweils C_1-C_4 -Alkyl, C_1-C_4 -Alkoxy, Methylthio, Halogen oder Alkoxyalkyl bedeuten.

Eine weitere Bevorzugung innerhalb der letztgenannten Gruppe geniessen die Verbindungen, in denen X für Sauerstoff oder Schwefel steht.

Ganz besonders bevorzugt sind hiervon wiederum jene, in denen A für $^{\rm C_2-C_8-Alkoxyalkyl}$, $^{\rm C_2-C_4-Halogenalkenyl}$ oder $^{\rm C_2-C_6-Alkenyl}$ steht.

Drei weiterhin aus der letzten Gruppe bevorzugte Untergruppen sind Gruppen von Verbindungen, in denen

- α) A für C₂-C₈-Alkoxyalkyl und R₃ und R₄ jeweils für Methyl, Aethyl, Chlor oder Methoxy,
- β) A für C_2 - C_6 -Alkenyl und R_3 und R_4 jeweils für Methyl, Aethyl, Chlor oder Methoxy und
- γ) A für die durch ein bis drei Halogenatome substituiertes Vinyl und R $_3$ und R $_4$ jeweils für Methyl, Aethyl, Chlor oder Methoxy stehen.

Von den Verbindungen der Formel I, in denen Z für Schwefel steht, sind diejenigen bevorzugt, in denen X Sauerstoff oder Schwefel, R₃ und R₄ jeweils unabhängig voneinander C₁-C₃-Alkyl, C₁-C₃-Alkoxy oder C₁-C₃-Alkylthio mit zusammen höchstens 4 Kohlenstoffatomen bedeuten und A für -CH₂-CH=CH₂, -CH₂-CH=CH-CH₃, -CH₂-CH(CH₃)=CH₂, Methoxyäthyl, Methoxymethyl oder -CCl=CHCl steht und der Rest -X-A die 2-Stellung besetzt und m die Zahl 1 bedeutet.

Als bevorzugte Einzelverbindung ist zu nennen:

N-(2-Allyloxyphenylsulfonyl)-N'-(4-methoxy-6-methyl-1,3,5-triazin-2-yl)-harnstoff.

Die Herstellung der Verbindungen der Formel I erfolgt in einem inerten, organischen Lösungsmittel.

Nach einem ersten Verfahren werden die Verbindungen der Formel I erhalten, indem man ein Phenylsulfonamid der Formel II

worin A, R₁, R₂, X und m die unter Formel I gegebene Bedeutung haben, in Gegenwart einer Base mit einem N-Pyrimidinyl-oder -Triazinylcarbamat der Formel III

$$\begin{array}{c}
\mathbb{Z} \\
\mathbb{N} = \mathbb{R}^{3} \\
\mathbb{N} = \mathbb{R}^{4}
\end{array}$$
(III)

worin E, R₃, R₄ und Z die unter Formel I gegebene Bedeutung haben, umsetzt.

Nach einem zweiten Verfahren gelangt man zu Verbindungen der Formel I, indem man ein Phenylsulfonylisocyanat oder -isothiocyanat der Formel IV

$$R_{1} \xrightarrow{\text{if } -SO_{2}-N=C=Z}$$

$$R_{2} \xrightarrow{\text{(X-A)}_{m}}$$
(IV)

worin A, R_1 , R_2 , m, X und Z die unter Formel I gegebene Bedeutung haben, gegebenenfalls in Gegenwart einer Base, mit einem Amin der Formel V

$$H_2^{N-\bullet} = R_3$$

$$R_4$$
(v)

worin E, R_3 und R_4 die unter Formel I gegebene Bedeutung haben, umsetzt.

Nach einem weiteren Verfahren werden die Verbindungen der Formel I hergestellt, indem man ein Sulfonamid der oben angegebenen Formel II gegebenenfalls in Gegenwart einer Base mit einem Isocyanat oder Isothiocyanat der Formel VI

$$Z=C=N-\bullet N=\bullet R_{3}$$

$$R_{4}$$
(VI)

worin E, R₃, R₄ und Z die unter Formel I gegebenen Bedeutung haben, umsetzt.

Schliesslich kann man die Verbindungen der Formel I auch erhalten, indem man ein N-Phenylsulfonylcarbamat der Formel VII

worin A, R₁, R₂, m und X die unter Formel I gegebene Bedeutung haben, mit einem Amin der oben angegebenen Formel V umsetzt.

Die erhaltenen Harnstoffe der Formel I können gewünschtenfalls mittels Aminen, Alkalimetall- oder Erdalkalimetallhydroxiden oder quaternären Ammoniumbasen in Salze übergeführt werden. Dieses geschieht beispiels- weise durch Umsetzen mit der äquimolaren Menge Base und Verdampfen des Lösungsmittels.

Die Ausgangsstoffe der Formeln II, IV und VII sind zum Teil neu und können nach folgenden Methoden hergestellt werden:

Die neuen und als Zwischenprodukte verwendeten Sulfonamide der Formel II wercen aus den entsprechenden Anilinen durch Diazotierung und Austuasch der Diazogruppe mit Schwefeldioxid in Gegenwart eines Katalysators wie Kupfer-I-chlorid in Salzsäure oder Essigsäure und Umsetzen des entstandenen Phenylsulfonylchlorids mit Ammoniumhydroxid-Lösung erhalten.

Die Verbindungen der Formel II können auch durch Sauerstoff- oder Schwefel-Alkylierung resp. Alkenylierung von Hydroxy- oder Thiophenylsulfonamiden mit den entsprechenden Halogeniden resp. Schwefelsäure- estern oder durch Umsatz von ortho-Halogenphenylsulfonamiden mit Metall-Alkoholaten resp. Mercaptiden und gegebenenfalls durch deren Oxidation z.B. mit Perjodaten resp. Persäuren zu den entsprechenden Sulfoxiden und Sulfonen,erhalten werden.

Ortho-Hydroxyphenyl- resp. substituierte ortho-Hydroxyphenylsulfonamide der Formel VIII,

worin R₁ und R₂ die unter Formel I angegebene Bedeutung haben und X' für Sauerstoff oder Schwefel steht, als Ausgangsprodukte bestimmter Sulfonamid-Vertreter der Formel II sind mit Ausnahme von ortho-Hydroxyphenylsulfonamid neu. Sie können durch Aetherspaltung der

entsprechenden C₁-C₄-Alkoxyphenylsulfonamiden z.B. mit Bortrihalogeniden (solche Umsetzungen sind in der US-Patentschrift 3,904,680 und in J. Am. Chem. Soc. <u>64</u>, 1128 (1942) beschrieben) oder durch Hydrogenolyse der entsprechenden Benzyloxyphenylsulfonamiden erhalten werden, wie in J. Chem. Soc. <u>1958</u>, 2903 beschrieben ist.

Die Alkoxyphenylsulfonamide wiederum können aus den entsprechenden Alkoxyaniliden wie bereits erwähnt oder durch Chlorsulfonylierung von Alkoxybenzolen und Umsatz der erhaltenen Phenylsulfonylchloriden mit Ammoniumhydroxyd-Lösung gewonnen werden. Solche Reaktionen sind aus J. Am. Chem. Soc. 62, 603 (1940) bekannt geworden.

Die als Zwischenprodukte verwendeten Verbindungen der Formeln II und VIII sind neu resp. z.T. neu und speziell für die Synthese von Verbindungen der Formel I entwickelt worden. Diese Zwischenprodukte bilden einen weiteren Aspekt der vorliegenden Erfindung.

Die Phenylsulfonylisocyanate der Formel IV können durch Umsetzungen der Sulfonamide der Formel II mit Phosgen in Anwesenheit von Butylisocyanat in einem chlorierten Kohlenwasserstoff als Lösungsmittel, bei Rückflusstemperatur erhalten werden. Aehnliche Darstellungen sind in "Newer Methods of Preparative Organic Chemistry" Band VI, 223-241, Academic Press New York und London, beschrieben.

Die Isothiocyanate der Formel IV werden durch Behandlung der Sulfonamide der Formel II mit Schwefelkohlenstoff und Kaliumhydroxid und anschliessender Umsetzung des Dikaliumsalzes mit Phosgen erhalten. Solche Verfahren sind in Arch. Pharm. 299, 174 (1966) beschrieben.

Die N-Phenylsulfonylcarbamate der Formel VII werden durch Umsetzung der Sulfonamide der Formel II mit Diphenylcarbamat in Gegenwart einer Base erhalten. Aehnliche Verfahren sind in der japanischen Patentschrift 61 169 erwähnt.

Die Ausgangsmaterialien der Formeln III, V und VI sind bekannt oder können nach bekannten Methoden hergestellt werden.

Durch Umsetzung von Aminen der Formel V mit Oxalylchlorid in chlorierten Kohlenwasserstoffen als Lösungsmittel, lassen sich Isocyanate der Formel VI herstellen. Amine der Formel V sind bekannt und zum Teil im Handel erhältlich oder sie können nach bekannten Methoden hergestellt werden, siehe "The Chemistry of Heterocyclic Compounds" Band XIV, Interscience Publishers, New York, London,

Die Umsetzungen zu Verbindungen der Formel I werden vorteilhafterweise in aprotischen, inerten, organischen Lösungsmitteln vorgenommen wie Methylenchlorid, Tetrahydrofuran, Acetonitril, Dioxan, Toluol.

Die Reaktionstemperaturen liegen vorzugsweise zwischen -20° und +120°C. Die Umsetzungen verlaufen im allgemeinen leicht exotherm und können bei Raumtemperatur durchgeführt werden. Zwecks Abkürzung der Reaktionszeit oder auch zum Einleiten der Umsetzung wird zweckdienlich für kurze Zeit bis zum Siedepunkt des Reaktionsgemisches aufgewärmt. Die Reaktionszeiten können ebenfalls durch Zugabe einiger Tropfen Base als Reaktionskatalysator beschleunigt werden.

Die Endprodukte können durch Einengen und oder Verdampfen des Lösungsmittels isoliert und durch Umkristallisieren oder Zerreiben des festen Rückstandes in Lösungsmitteln in denen sie sich nicht gut lösen, wie Aether, aromatischen Kohlenwasserstoffen oder chlorierten Kohlenwasserstoffen gereinigt werden.

Die Wirkstoffe der Formel I sind stabile Verbindungen. Ihre Handhabung bedarf keiner vorsorglicher Massnahmen.

Die Verbindungen der Formel I haben starke pflanzenwuchsregulierende, insbesondere pflanzenwuchshemmende, Eigenschaften. Es werden sowohl Monokotyledonen als auch Dikotyledonen in ihrem Wachstum beeinträchtigt.

So können z.B. die in der Landwirtschaft in tropischen Gegenden häufig als "cover crops" (Bodenbedecker) angepflanzten Leguminosen durch die Verbindungen der Formel I in ihrem Wachstum selektiv gehemmt werden, so dass zwar die Bodenerosion zwischen den Kulturpflanzen verhindert wird, die "cover crops" jedoch nicht zur Konkurrenz für die Kultur werden können.

Weiter eignen sich die Verbindungen der Formel I um das Keimen von eingelagerten Kartoffeln zu verhindern. Bei Kartoffeln entwickeln sich bei der Einlagerung über den Winter häufig Keime, die Schrumpfen, Gewichtsverlust und Faulen zur Folge haben.

Bei gröseren Aufwandmengen werden alle getesteten Pflanzen in ihrer Entwicklung so geschädigt, dass sie absterben.

Bei geringeren Aufwandmengen zeichnen sich die Verbindungen der Formel I durch gute selektiv-wuchshemmende und selektiv-herbizide Eigenschaften aus, die sie ausgezeichnet zum Einsatz in Kulturen von Nutzpflanzen, insbesondere in Getreide, Baumwolle, Soja, Mais und Reis, befähigen. Es werden dabei teilweise auch Unkräuter geschädigt, welchen bisher nur mit Totalherbiziden beizukommen war.

Die Wirkungsart dieser Wirkstoffe ist unüblich. Sie sind in vielen Fällen translozierbar, d.h. sie werden von der Pflanze aufgenommen und an andere Stellen transportiert, wo sie dann zur Wirkung kommen. Das unübliche daran ist, dass die Wirkstoffe nicht nur den Weg durch die Gefässbündel im Holzteil von den Wurzeln in die Blätter nehmen, sondern auch durch die Siebröhren im Bastteil von den Blättern zurück in die Wurzel transloziert werden können. So gelingt es beispielsweise durch Oberflächenbehandlung perenierende Unkräuter bis in die Wurzeln zu schädigen. Die neuen Verbindungen der Formel I wirken bereits bei – im Vergleich zu anderen Herbiziden und Wuchsregulatoren – sehr geringen Aufwandmengen.

Die Erfindung betrifft auch herbizide und pflanzenwachstumsregulierende Mittel, welche einen neuen Wirkstoff der Formel I enthalten, sowie Verfahren zur pre- und post-emergenten Unkrautbekämpfung und zur Hemmung des Pflanzenwuches von monokotylen und dikotylen Pflanzen, insbesondere Gräsern, tropischen Bodenbedeckern und Tabakgeiztrieben.

Die Verbindungen der Formel I werden in unveränderter Form oder vorzugsweise als Mittel zusammen mit den in der Formulierungstechnik üblichen Hilfsmitteln eingesetzt und werden daher z.B. zu Emulsionskonzentraten, direkt versprühbaren oder verdünnbaren Lösungen, verdünnten Emulsionen, Spritzpulvern, löslichen Pulvern Stäubemitteln, Granulaten, auch Verkapselungen in z.B. polymeren Stoffen in bekannter Weise verarbeitet. Die Anwendungsverfahren wie Versprühen, Vernebeln, Verstäuben, Verstreuen oder Giessen werden gleich wie die Art der Mittel den angestrebten Zielen und den gegebenen Verhältnissen entsprechend gewählt.

Die Formulierungen, d.h. die den Wirkstoff der Formel I und gegebenenfalls einen festen oder flüssigen Zusatzstoff enthaltenden Mittel, Zubereitungen oder Zusammensetzungen werden in bekannter Weise hergestellt, z.B. durch inniges Vermischen und oder Vermahlen der Wirkstoffe mit Streckmitteln, wie z.B. mit Lösungsmitteln, festen Trägerstoffen, und gegebenenfalls oberflächenaktiven Verbindungen (Tensiden).

Als Lösungsmittel können in Frage kommen: Aromatische Kohlenwasserstoffe, bevorzugt die Fraktionen C₈ bis C₁₂, wie z.B. Xylolgemische oder substituierte Naphthaline, Phthalsäureester wie Dibutyl- oder Dicotylphthalat, aliphatische Kohlenwasserstoffe wie Cyclohexan oder Paraffine, Alkohole und Glykole sowie deren Aether und Ester, wie Aethanol, Aethylenglykol, Aethylenglykolmonomethyl- oder äthyläther, Ketone wie Cyclohexanon, stark polare Lösungsmittel wie N-Methyl-2-pyrrolidon, Dimethylsulfoxid oder Dimethylformamid, sowie gegebenenfalls epoxidierte Pflanzenöle, wie epoxidiertes Kokosnussöl oder Sojaöl; oder Wasser.

Als feste Trägerstoffe, z.B. für Stäubemittel und dispergierbare Pulver, werden in der Regel natürliche Gesteinsmehle verwendet, wie Calcit, Talkum, Kaolin, Montmorillonit oder Attapulgit. Zur Verbesserung der physikalischen Eigenschaften können auch hochdisperse Kieselsäure oder Hochdisperse saugfähige Polymerisate zugesetzt werden. Als gekörnte, adsorptive Granulatträger kommen poröse Typen wie z.B. Bimsstein, Ziegelbruch, Sepiolit oder Bentonit, als nicht sorptive Trägermaterialien z.B. Calcit oder Sand in Frage. Darüberhinaus kann eine Vielzahl von vorgranulierten Materialien anorganischer oder organischer Natur wie insbesondere Dolomit oder zerkleinerte Pflanzenrückstände verwendet werden.

Als oberflächenaktive Verbindungen kommen je nach der Art des zu formulierenden Wirkstoffes der Formel I nichtionogene, kation- und oder anionaktive Tenside mit guten Emulgier-, Dispergier- und Netzeigenschaften in Betracht. Unter Tensiden sind auch Tensidgemische zu verstehen.

Geeignete anionische Tenside können sowohl sog. wasserlösliche Seifen als auch wasserlösliche synthetische oberflächenaktive Verbindungen sein.

Als Seifen seien die Alkali-, Erdalkali- oder gegebenenfalls substituierte Ammoniumsalze von höheren Fettsäuren (C₁₀-C₂₂), wie z.B. die Na- oder K-Salze der Oel- oder Stearinsäure, oder von natürlichen Fettsäuregemischen, die z.B. aus Kokosnuss- oder Talgöl gewonnen werden können, genannt. Ferner sind auch die Fettsäure-methyl-taurinsalze zu erwähnen.

Häufiger werden jedoch sogenannte synthetische Tenside verwendet, insbesondere Fettsulfonate, Fettsulfate, sulfonierte Benzimidazolderivate oder Alkylarylsulfonate.

Die Fettsulfonate oder -sulfate liegen in der Regel als Alkali-, Erdalkali- oder gegebenenfalls substituierte Ammoniumsalze vor und

weisen einen Alkylrest mit 8 bis 22 C-Atomen auf, wobei Alkyl auch den Alkylteil von Acylresten einschliesst, z.B. das Na- oder Ca-Salz der Ligninsulfonsäure, des Dodecylschwefelsäureesters oder eines aus natürlichen Fettsäuren hergestellten Fettalkoholsulfatgemisches. Hierher gehören auch die Salze der Schwefelsäureester und Sulfonsäuren von Fettalkohol-Aethylenoxid-Addukten. Die sulfonierten Benzimidazolderivate enthalten vorzugswiese 2 Sulfonsäuregruppen und einen Fettsäurerest mit 8-22 C-Atomen. Alkylarylsulfonate sind z.B. die Na-, Ca- oder Triäthanolaminsalze der Dodecyclbenzolsulfonsäure, der Dibutylnaphthalinsulfonsäure oder eines Napthalinsulfonsäure-Formaldehydkondensationsproduktes.

Ferner kommen auch entsprechende Phosphate wie z.B. Salze des Phosphorsäureesters eines p-Nonylphenol-(4-14)-Aethylenoxid-Adduktes in Frage.

Als nicht ionische Tenside kommen in erster Linie Polyglykolätherderivate von aliphatischen oder cycloaliphatischen Alkoholen, gesättigten oder ungesättigten Fettsäuren und Alkylphenolen in Frage, die
3 bis 30 Glykoläthergruppen und 8 bis 20 Kohlenstoffatome im
(aliphatischen) Kohlenwasserstoffrest und 6 bis 18 Kohlenstoffatome
im Alkylrest der Alkylphenole enthalten können.

Weitere geeignete nichtionische Tenside sind die wasserlöslichen, 20 bis 250 Aethylenglykoläthergruppen und 10 bis 100 Propylenglykoläthergruppen enthaltenden Polyäthylenoxidaddukte an Polypropylenglykol, Aethylendiaminopolypropylenglykol und Alkylpolypropylenglykol mit 1 bis 10 Kohlenstoffatomen in der Alkylkette. Die genannten Verbindungen enthalten üblicherweise pro Propylenglykol-Einheit 1 bis 5 Aethylenglykoleinheiten.

Als Beispiele nichtionischer Tenside seien Nonylphenolpolyäthoxy-äthanole, Ricinusölpolyglykoläther, Polypropylen-Polyäthylenoxid-addukte, Tributylphenoxypolyäthanol, Polyäthylenglykol und Octylphenoxypolyäthoxyäthanol erwähnt.

Ferner kommen auch Fettsäureester von Polyoxyäthylensorbitan wie das Polyoxyäthylensorbitan-trioleat in Betracht.

Bei den kationischen Tensiden handelt es sich vor allem um quaternäre Ammoniumsalze, welche als N-Substituenten mindestens einen Alkylrest mit 8 bis 22 C-Atomen enthalten und als weitere Substituenten niedrige, gegebenenfalls halogenierte Alkyl-, Benzyl- oder niedrige Hydroxyalkylreste aufweisen. Die Salze liegen vorzugsweise als Halogenide, Methylsulfate oder Aethylsulfate vor, z.B. das Stearyltrimethylammoniumchlorid oder das Benzyldi(2-chloräthyl)äthylammoniumbromid.

Die in der Formulierungstechnik gebräuchlichen Tenside sind u.a. in folgenden Publikationen beschrieben:

"Mc Cutcheon's Detergents and Emulsifiers Annual" MC Publishing Corp., Ringwood, New Jersey, 1979.
Sisely and Wood, "Encyclopedia of Surface Active Agents", Chemical Publishing Co., Inc. New York, 1964.

Die pestiziden Zubereitungen enthalten in der Regel 0,1 bis 95%, insbesondere 1 bis 80%, Wirkstoff der Formel I, 1 bis 99% eines festen oder flüssigen Zusatzstoffes und 0 bis 25%, insbesondere 0,1 bis 25% eines Tensides.

Insbesondere setzen sich bevorzugte Formulierungen folgendermassen zusammen: (Z = Gewichtsprozent)

Lösungen

Aktiver Wirkstoff: 1 bis 30%, vorzugsweise 5 bis 20% Lösungsmittel: 99 bis 0%, vorzugsweise 95 bis 0% oberflächenaktives Mittel: 0 bis 99%, vorzugsweise 0 bis 95%.

Emulgierbare Konzentrate

Aktiver Wirkstoff: 1 bis 20%, bevorzugt 5 bis 10%

oberflächenaktives Mittel: 5 bis 30%, vorzugsweise 10 bis 20%

flüssiges Trägermittel: 50 bis 94%, vorzugsweise 70 bis 85%.

Stäube

Aktiver Wirkstoff: 0,1 bis 10%, vorzugsweise 0,1 bis 1%

festes Trägermittel: 99,9 bis 90%, vorzugsweise 99,9 bis 99%.

Suspension-Konzentrate

Aktiver Wirkstoff: 5 bis 75%, vorzugsweise 10 bis 50%

Wasser: 94 bis 25%, vorzugsweise 90 bis 30%

oberflächenaktives Mittel: 1 bis 40%, vorzugsweise 2 bis 30%.

Benetzbare Pulver

Aktiver Wirkstoff: 0,5 bis 90%, vorzugsweise 1 bis 80%

oberflächenaktives Mittel: 0,5 bis 20%, vorzugsweise 1 bis 15%

festes Trägermittel: 5 bis 95, vorzugsweise 15 bis 90%.

Granulate

Aktiver Wirkstoff: 0,5 bis 30%, vorzugsweise 3 bis 15%

festes Trägermittel: 99,5 bis 70%, vorzugsweise 97 bis 85%.

Während als Handelsware eher konzentrierte Mittel bevorzugt werden, verwendet der Endverbraucher in der Regel verdünnte Mittel. Die Anwendungsformen können bis hinab zu 0,001% an Wirkstoff verdünnt werden. Die Aufwandmengen betragen in der Regel 0,01 bis 10 kg AS/ha, vorzugsweise 0,025 bis 5 kg AS/ha.

Die Mittel können auch weitere Zusätze wie Stabilisatoren, Entschäumer, Viskositätsregulatoren, Bindemittel, Haftmittel sowie Dünger oder ander Wirkstoffe zur Erzielung spezieller Effekte enthalten. In den folgenden Beispielen sind die Temperaturen in Celsiusgraden °C, die Drücke in Millibar mb angegeben.

Herstellungsbeispiele:

Beispiel 1: 2-Hydroxyphenylsulfonamid

Zu einer Suspension von 39 g 2-Methoxyphenylsulfonamid in 210 ml trockenem Methylenchlorid lässt man unter Stickstoffatmosphäre bei Raumtemperatur innerhalb von 15 Minuten 22,2 ml Bortribromid zutropfen. Die Reaktionsmischung wird danach für 1 Stunde bei Raumtemperatur gerührt. Anschliessend werden zur auf 0°C gekühlten Mischung innerhalb von 15 Minuten 200 ml Methanol zugesetzt und die klare Lösung eingedampft. Der ölige Rückstand wird in Aethylacetat aufgenommen, zweimal mit Wasser gewaschen, mit Natriumsulfat getrocknet und eingedampft. Durch Verreiben des Rückstandes mit Petroläther erhält man 25,1 g 2-Hydroxyphenylsulfonamid vom Schmelzpunkt 136-138°C.

In analoger Weise werden in in der folgenden Tabelle aufgelisteten Hydroxyphenylsulfonamide der Formel VIII erhalten. Tabelle 1:

	1		
R ₁	R ₂	Stellung von -OH	physikal. Daten
5-CH CH ₃	H	. 2	Smp. 90-91°
2-CH ₃	н	· . 5	ت .
2-C1 ·	Н	5	
5-F	н	2	Smp. 141-142°
5-Br	H	2	Smp. 169-70°
5-NO ₂	H	2	Smp. 180-185°
3-СН ₃	н	2	Smp. 133-134°
2-CH ₃	Н	3	
3-C1	н	2	
6-CH ₃	н	2	
3-OCH ₃	н	2	
2-OCH ₃	н	3	
3-CH ₃	5-t-C ₄ H ₉	2	Smp. 134-137°

Tabelle 1: (Fortsetzung)

R ₁	R ₂	Stellung von	physikal. Daten
6-0CH ₃	Н	2	
6-ОН	н	2	
5-0CH ₃	Н	2	Smp. 119-20°
2-0CH ₃	Н	5	Smp. 213-15°
5-CH ₃	н	2	Smp. 155-156°
6-C1	Н	2	Smp. 190-91°
3-NO ₂	H	2	
3-COOCH ₃	Н	2	
5-COOCH ₃	Н	2	Smp. 171-172°
5 - C1	H	2	Smp. 176-179°
5-NO ₂	3-CF ₃	2	
5-NO ₂	3-C1	2	
5-CF ₃	3-NO ₂	2	
5-CH ₃	3-CH ₃	2	
5-C1	3-NO ₂	2	
5 - C1	3-C1	2	Smp. 156-158°
5-Br	3-0CH ₃	2	
5-Br	2-осн ₃	3	Smp. 194-197°
3-0CH ₃	5-COOCH ₃	2	·
2-0CH ₃	5-COOCH ₃	3	
5-CH ₃	3-Br	2	
5-Br	3-NO ₂	2	
5-Br	3-соосн ₃	2	

Tabelle 1: (Fortsetzung)

R ₁	R ₂	Stellung von -OH	physikal. Daten
5-соосн ₃	3-NO ₂	2	
5-C1	3-Br	2	Smp. 247-249°
3-NH ₂	Н	2	
5-NH ₂	Н	2	
5-COOC ₃ H ₇ (i)	3-NO ₂	2	
5-CON(CH ₃) ₂	н	2	
6-NO ₂	Н	2	
- 6-соосн ₃	н	2	

Beispiel 2: 2-Allyloxyphenylsulfonamid

Eine Mischung von 3,5 g 2-Hydroxyphenylsulfonamid, 5,5 g Pottasche und 1,7 ml Allylbromid in 100 ml Methyläthylketon wird unter Stickstoff-atmosphäre bei Rückflusstemperatur während 1 Stunde gerührt. Das Reaktionsgemisch wird auf Raumtemperatur abgekühlt, filtriert und eingedampft. Man erhält nach einmaligem Umkristallisieren aus Aethylacetat 3,27 g 2-Allyloxyphenylsulfonamid vom Schmelzpunkt 104-105°C.

Analog herzustellende Sulfonamide der Formel II sind in der anschliessenden Tabelle aufgelistet.

Tabelle 2:

					
R ₁	R ₂	X	A	A Stellung von -X-A	
Н	н	0	-CC1=CHC1	2	Smp. 147-149°
H	Н	S	-CC1=CHC1	2	
Н	H	so	-CC1=CHC1	2	
н	н	so ₂	-CC1=CHC1	2	
H	H	0	-CH=CC1 ₂	2	
н	Н	S	-CH=CC1 ₂	2	
H	Н	SO	-CH=CC1 ₂	2	
н	н	so ₂	-CH=CC1 ₂	2	
H	H	0	-сн ₂ сн=сн ₂	2	Smp. 104-5°
Н	Н	S	-CH ₂ CH=CH ₂	2	
H	H	0	- СН ₃ -СН ₂ -С=СН ₂	2	Smp. 104-105°
Н	H	S	СН ₃ -СН ₂ -С=СН ₂	2	
н	Н	0 -	-(CH ₂) ₂ -CH=CH ₂	2	
н	H	0	-(CH ₂) ₃ -CH=CH ₂	2	
н	н	0	-CH ₂ -CH=CCCH ₃	2	
н	н	S	-CH ₂ -CH=CCCH ₃ CH ₃	2	
н	н	0	-CH ₂ -CH=CH-CH ₃	2	Smp. 113-114°

Tabelle 2: (Fortsetzung)

R ₁	R ₂	x		Stellung von-X-A	phys. Daten
н	,H	S	-CH ₂ -CH=CH-CH ₃	2	
H	н	0	-ch ^{CH} ₃	2	
H —	H	S	-CH ^{CH} 3	2	·
н	Н	0	-сн ₂ -осн ₃	2	Zers. ab 121°
Ħ	H	0	-сн ₂ -ос ₂ н ₅	2	
H	н	0	-сн ₂ -s-сн ₃	2	
H	н	0	-сн ₂ сн ₂ -осн ₃	2	Smp. 110-112°
Н	Н	s	-сн ₂ сн ₂ -осн ₃	2	
H	Н	0	-сн ₂ сн ₂ -ос ₂ н ₅	2	
Н	Н	0	-CH ₂ CH ₂ -SCH ₃	2	-
6-C1	н	0	-CH ₂ CH=CH ₂	2	Smp. 127-128°
6-C1	- Н	0	-сн ₂ -с=сн ₂	2	
6-C1	H	0	-CH ₂ -CH=GCH ₃	2	
6-C1	Н	0	-сн ₂ осн ₃	2	
6-C1	Н	0	-(CH ₂) ₂ OCH ₃	2	
6-C1	Н	0	-сн ₂ scн ₃	2	
6-C1	H	0	-(CH ₂) ₂ SCH ₃	2	
6-C1	н	0	-сн ₂ -сн=сн-сн ₃	2	
6-0CH ₃	н	0	-сн ₂ -сн=сн ₂	2	

Tabelle 2: (Fortsetzung)

R ₁	R ₂	х	A	Stellung von -X-A	phys. Daten
6-0CH ₃	н	0	СН ₃ -СН ₂ -С=СН ₂	2	
6-осн ₃	Н	0	-(CH ₂) ₂ -OC ₂ H ₅	2	
6-0CH ₃	н	0	-сн ₂ -сн=с сн ₃	2	
6-0CH ₃	Н	0	-(CH ₂) ₂ -CH=CH ₂	2	
6-сн ₃	H	0	-CH ₂ -CH=CH ₂	2	
6-сн ₃	H	0	СН ₃ -СН ₂ -С=СН ₂	2	
6-CH ₃	H	0	-(CH ₂) ₂ -OCH ₃	2	
6-CH ₃	. н	0	-CH ₂ SCH ₃	2	
H	H	0	-CH ₂ CH ₂ -OCH ₂ CH=CH ₂ .	2	-
6-NO ₂	H	0	-CH ₂ -CH=CH ₂	2	
6-NO ₂	н	0	-сн ₂ -сн=сн-сн ₃	2	
6-NO ₂	H	0	-сн ₂ -осн ₃	2	
6-NO ₂	Н	0	-сн ₂ -сн ₂ -ос ₂ н ₅	2	
6-no ₂	Ħ	0	СН ₂ -С=СН ₂	2	
6-соосн ₃	н	0	-CH ₂ -CH=CH ₂	2	
5-C1	H	0	-CH ₂ -CH=CH ₂	2	Smp. 122°
5 - C1	H	0	СH ₂ -С=СH ₂	2	
5-Br	H	0	СН ₃ -СН ₂ -С=СН ₂ СН ₃ -СН ₂ -С=СН ₂	2	

Tabelle 2: (Fortsetzung)

R ₁	R ₂	х	A Stellung von-X-A		phys. Daten
5-Br	H	0	-CH ₂ -CH=CH ₂ 2		Smp. 110-111°
5-Br	H.	٥ .	-сн ₂ -осн ₃	2	
5-F _	Н	0	-CH ₂ -CH=CH ₂	2	Smp. 113-114°
5-F	н	0	-CH ₂ -CH=CCH ₃	2	·
5-CH CH ₃	Н	0	-CH ₂ -CH=CCH ₃	2	
5-CH CH ₃	н	0	-ch ₂ -ch=ch ₂	2	Oel
5-CH CH ₃	н	0	-сн ₂ сн ₂ осн ₃	2	
5-CH ₃	Н	0	-сн ₂ сн ₂ осн ₃	2	
5-CH ₃	н	0	-CH ₂ -CH=CH ₂	2	Smp. 139-140°
5-CH ₃	н	0	-сн ₂ -сн=сн-сн ₃	2	
5-NO ₂	Н	0	-сн ₂ -сн=сн-сн ₃	2	
5-NO ₂	H	0	-сн ₂ -s-сн ₃	2	
5-NO ₂	Н	0	-сн ₂ сн=сн ₂	2	Smp. 138-141°
5-0CH ₃	н	0	-CH ₂ CH=CH ₂	2	Smp. 88-89°
5-0CH ₃	Н	0	CH ₃ -CH ₂ -C=CH ₂ 2		
5-0CH ₃	Н	0	-CH ₂ CH=CH-CH ₃ 2		
5-0CH ₃	H	0	-сн ₂ осн ₃		
5-OCH ₃	Н	0	-CH ₂ CH ₂ -SCH ₃	2	

Tabelle 2: (Fortsetzung)

R ₁	R ₂	х	A	Stellung von-X-A	phys. Daten
5-CON CH ₃	- H	0	-сн ₂ -сн=сн ₂	2	
5-CON CH ₃	Н	0	СН ₃ -СН ₂ -С=СН ₂	2	
5-COOCH ₃	н	0	-CH ₂ -CH=CH ₂	2	
5-COOCH ₃	H	0	СН ₃ -СН ₂ -С=СН ₂	2	
5-COOCH ₃	H	0	-CH ₂ -OC ₂ H ₅	2	
5-NO ₂	3-CF ₃	0	-сн ₂ -сн=сн ₂	2	
5-NO ₂	3-C1	0	-сн ₂ -сн=сн ₂	2	
5-NO ₂	3-C1	0	СН ₃ -СН ₂ -С=СН ₂	2	·
5-CF ₃	3-NO ₂	0	-сн ₂ -сн=сн ₂	2	
5-CH ₃	3-CH ₃	0	-сн ₂ -сн=сн ₂	2	
5-CH ₃	3-CH ₃	0	-CH ₂ -CH=CH-CH ₃	2	
5 - C1	3-NO ₂	0	-сн ₂ -сн=сн-сн ₃		
5-C1	3-C1	0	-CH ₂ -CH=CH ₂	2	Smap. 161-162°
5-C1	3-C1	0	-CH ₂ -CH ₂ -OCH ₃	2	
5-C1	3-C1	0	-сн ₂ -осн ₃	2	
5-Br	3-осн ₃	0	-CH ₂ -CH=CH ₂	2	
5-Br	2-0CH ₃	0	-CH ₂ -CH=CH ₂	3	Harz
3-осн ₃	5-COOCH ₃	0	-CH ₂ -CH=CH ₂	2	
2-0CH ₃	5-COOCH ₃	0	СН ₃ -СН ₂ -С=СН ₂	3	

Tabelle 2: (Fortsetzung)

R ₁	R ₂	х	A	A Stellung von -X-A	
5-CH ₃	3-Br	0	-сн ₂ -осн ₃	2	
5-Br	3-NO ₂	0	-CH ₂ CH=CH ₂	2	
5-C1	3-Br	0	-сн ₂ сн=сн ₂	2	Smp. 179°
5-C1	3-Br	0	Сн ₃ -сн ₂ -с=сн ₂	2	;
5-C1	3-Br	0	-сн ₂ -сн ₂ -осн ₃	3	
н	Н	so	-сн ₂ -сн=сн ₂	2	
H	Н	so ₂	-CH ₂ -CH=CH ₂	2	
н	H	so	-сн ₂ -сн=сн-сн ₃	2	44 (44) 1 (44) 1 (44)
н	Ħ	so ₂	-CH ₂ -CH=CH-CH ₃	2	
H	H	0	-CH ₂ -SO-CH ₃	2	
н	H	0	-сн ₂ -so ₂ -сн ₃	2	
н	н	0	-CH ₂ -CH ₂ -SO-CH ₃	2	
н	н	0	-сн ₂ -сн ₂ -sо ₂ -сн ₃	2	
Н	Ħ	0	С1 -сн ₂ -с=сн ₂	. 2	
н	н	0	С1 -сн ₂ -с=сн-с1	2	
н	н	0	С1 -СН ₂ -СН=С-СН ₃	2	
н	н	0	-CH ₂ -CH=C C1	2	
5-CH ₃	Н	0	C1 -CH ₂ -C=CH ₂	2	
5-NO ₂	н	0	C1 -CH ₂ -C=CH-C1	2	

Tabelle 2: (Fortsetzung)

R ₁	R ₂	х	A Stellung von-X-A		phys. Daten
5-Br	H	0	С1 -СН ₂ -С-СН ₂	2	
5-C1	H	0	-CH ₂ -CH=CC1	2	
5-CH(CH ₃) ₂	н	0	С1 -СН ₂ -СН=С-СН ₃	2	
3-CH ₃	н	0	С1 -сн ₂ -с=сн ₂	2	
6-CH ₃	Ħ	0	С1 -СН ₂ -С-СН ₂	2	
6-0CH ₃	H	0	с1 -сн ₂ -с=сн-с1	· 2	
5-0CH ₃	т Н	0	С1 -СH ₂ -СН=С С1	2	
6-C1	н	0	С1 -сн ₂ -с=сн ₂	2	
3-NO ₂	н	0	С1 -СН ₂ -СН=С-СН ₃	2	
3-CH ₃	н	0	-сн ₂ -сн=сн ₃	2	Smp. 114-116°
3-NO ₂	H	0	-сн ₂ -сн=сн ₃	2	
3-C1	Н	0	-CH ₂ -CH=CH ₃	2	
3-C1	H	0	-сн ₂ -сн=сн-сн ₃	2	
3-C1	н	0	сн ₃ -сн-с=сн ₂	2	
3-OCH ₃	н	0	сн ₃ -сн-с=сн ₂	2	
3-0CH ₃	H	0	-CH ₂ -CH=CH ₂	2	
2-осн ₃	H	0	-сн ₂ -сн=сн ₂	5	Smp. 113-114°

Beispiel 3:

a) N-(2-Allyloxyphenylsulfonyl)-phenyl-carbamat

Zur Suspension von 0,56 g Natriumhydrid (55%) in 5 ml absolutem
Dimethylformamid lässt man bei höchstens 20°C unter einer Stickstoffatmosphäre innerhalb von 5 Minuten 2,76 g 2-Allyloxyphenylsulfonamid
in 20 ml Dimethylformamid zutropfen und rührt vor dem tropfenweisen
Zusatz von 2,91 g Diphenylcarbamat in 20 ml Dimethylformamid die
Suspension für ca. 10 Minuten. Nach weiterem Rühren für 0,5 Stunden
wird das Reaktionsgemisch mit einer Mischung von 80 ml Aethylacetat,
80 g Eis und 12,3 ml 2N Salzsäure aufgenommen. Die organische Phase
wird zweimal mit Eiswasser gewaschen, über Natriumsulfat getrocknet
und eingedampft. Kristallisation aus Aether/Petroläther (1:1) ergibt
3,5 g N-(2-Allyloxyphenylsulfonyl)-phenyl-carbamat, Smp. 140-141°C.

b) N-(2-Allyloxyphenylsulfonyl)-N'-(4-methoxy-6-methyl-1,3,5-triazin-2-yl)-harnstoff

Eine Mischung von 3,33 g N-(2-Allyloxyphenylsulfonyl)-phenyl-carbamat und 1,4 g 2-Amino-4-methoxy-6-methyl-1,3,5-triazin in 30 ml absolutem Dioxan wird für 0,5 Stunden zum Rückfluss erhitzt, danach auf 20°C abgekühlt, filtriert, eingedampft und aus Aether kristallisiert. Durch Umkristallisieren aus Aethylacetat/Petroläther (1:1) erhält man 2,0 g N-(2-Allyloxyphenylsulfonyl)-N'-(4-methoxy-6-methyl-1,3,5-triazin-2-yl)-harnstoff, Smp. 146-147°C.

In analoger Weise werden die in der folgenden Tabelle aufgelisteten Verbindungen der Formel I hergestellt. Tabelle 3:

		-	· · · · · · · · · · · · · · · · · · ·			
Nr.	A	R ₁	R ₃	R ₄	x	E
1	-сн ₂ -сн=сн ₂	6-C1	CH ₃	OCH ₃	0	N
2	-сн ₂ -сн=сн ₂	6-C1	CH3	OCH ₃	0	СН
3	-сн ₂ -сн=сн ₂	6-C1	с ₂ н ₅	OCH3	0	N
4	-сн ₂ -сн=сн ₂	6-C1	OCH ₃	OCH3	0	СН
5	-сн ₂ -сн=сн ₂	6-C1	OCH ₃	OCH ₃ .	0	N
6	СН ₃ -СН ₂ -С=СН ₂	6-C1	CH ₃	осн3	0	N
7	СН ₃ -СН ₂ -С=СН ₂	6 - C1	CH ₃	осн ₃	0	СН
8	-сн ₂ -с=сн ₂	6-C1	^С 2 ^Н 5	OCH ₃	0	N
9	сн ₃ -сн ₂ -с=сн ₂	6-C1	осн3	осн ₃	0	N
10	СН ₂ -С=СН ₂	6 - C1	- осн ₃	OCH3	0	СН
11	-сн ₂ -сн=сн-сн ₃	6 - C1	OCH ₃	0СН3	0	СН
12	-сн ₂ -сн=сн-сн ₃	6 - C1	осн ₃	OCH3	0	N
13	-сн ₂ -сн=сн-сн ₃	6-C1	OCH3	сн3	0	N
14	-сн ₂ -сн=сн-сн ₃	6-C1	осн ₃	CH ₃	0	СН
15	-CH ₂ CH=CCH ₃ CH ₃	6 - C1	CH ₃	осн ₃	0	N

Tabelle 3: (Fortsetzung)

Nr.	A	R ₁	R ₃	R ₄	х	E
16	-CH ₂ -CH=CCH ₃	6-C1	сн ₃	осн3	0	СН
17	-сн ₂ -осн ₃	6-C1	CH3	OCH ₃	0	СН
18	-сн ₂ -осн ₃	6-C1	CH ₃	OCH ₃	0	N
19	-сн ₂ -осн ₃	6-C1	C ₂ H ₅	осн ₃	0	N
20	-(CH ₂) ₂ -OCH ₃	6-C1	CH ₃	OCH ₃	0	N
21	-(CH ₂) ₂ -OCH ₃	6-C1	CH ₃	OCH ₃	0	СН
22	-CH ₂ -SCH ₂	6 - C1	CH ₃	OCH ₃	0	СН
23	-CH ₂ -SCH ₂	6-C1	CH ₃	OCH ₃	0	N
24	-(CH ₂) ₂ -SCH ₂	6-C1	CH ₃	OCH ₃	0	N
25	-(CH ₂) ₂ -SCH ₂	6-C1	CH ₃	OCH ₃	0	СН
26	-CH ₂ CH=CH ₂	6-осн ₃	CH ³	OCH ₃	0	СН
27	-CH ₂ CH=CH ₂	6-осн ₃	CH ₃	OCH ₃	0	N
28	-CH ₂ CH=CH ₂	6-осн ₃	C ₂ H ₅	OCH ₃	0	N
29	-CH2CH=CH2	6-0CH ₃	OCH ₃	осн ₃	0	N
30	-CH ₂ CH=CH ₂	6-0CH ₃	осн ₃	OCH ₃	0	СН
31	СН ₂ -С=СН ₂	6-0CH ₃	OCH ₃	осн ₃	0	СН
32	CH ₃ -CH ₂ -C=CH ₂	6-0CH ₃	CH ₃	осн ₃	0	N
33	CH ₃ -CH ₂ -C=CH ₂	6-осн ₃	CH ₃	осн ₃	0	СН
34		6-0CH ₃	CH ₃	OCH ₃	0	СН
3.	$-(CH_2)_2 - OC_2H_5$	6-осн	CH ₃	OCH ₃	0	N

Tabelle 3: (Fortsetzung)

Nr.	A	R ₁	R ₃	R ₄	X	E	phys.Daten
36	-сн ₂ -сн=с сн ₃	6 – C1	CH ₃	осн ₃	0	N	
37	-CH ₂ -CH=CCH ₃	6-C1	CH ₃	осн3	0	СН	
38	С1 -СH-С=СН ₂	6-0CH ₃	CH ₃	оснз	0	N	
39	С1 -СH-С=СН ₂	6-0CH ₃	CH ₃	OCH ₃	0	СН	
40	С1 -СH-С=СН ₂	6-C1	CH ₃	осн ₃	0	СН	Smp 163-164°
41	С1 -СН-С=СН ₂	6-C1	CH ₃	осн ₃	0	N	Smp.142-145°
42	-сн ₂ -сн=сн ₂	6-CH ₃	CH ₃	осн ₃	0	N .	
43	-сн ₂ -сн=сн ₂	6-CH ₃	СНЗ	осн ₃	0	CH	
44	-сн ₂ -сн=сн ₂	6-CH ₃	OCH ₃	осн3	0	СН	
45	-CH ₂ -CH=CH ₂	6-CH ₃	OCH ₃	осн ₃	0	N	
46	СН ₃ -СН ₂ -С=СН ₂	6-CH ₃	CH3	осн3	0	N	
47	СН ₃ -СН ₂ -С=СН ₂	6-CH ₃	CH ₃	осн3	0	СН	
48	СН ₃ -СН ₂ -С=СН ₂	6-CH ₃	осн ₃	оснз	0	N	
49	СН ₃ -СН ₂ -С=СН ₂	6-CH ₃	осн3	осн ₃	0	СН	
50	-сн ₂ -осн ₃	6-CH ₃	осн ₃	OCH ³	0	СН	
51	-сн ₂ -осн ₃	6-CH ₃	осн3	CH ₃	0	СН	
52	-сн ₂ -осн ₃	6-CH ₃	осн ³	CH ₃	0	N	

Tabelle 3: (Fortsetzung)

Nr.	A	R ₁	R _. 3	R ₄	x	E
53	-(CH ₂) ₂ -CH=CH ₂	6-0CH ₃	осн ₃	CH ₃	0	N
54	-(CH ₂) ₂ -CH=CH ₂	6-0CH ₃	осн ₃	CH ₃	0	СН
55	-CH ₂ -SCH ₃	6-CH ₃	осн ₃	CH ₃	0	СН
56	-сн ₂ -sсн ₃	6-CH ₃	осн ₃	CH ₃	0	N
57	-CH ₂ -CH=CH ₂	6-NO ₂	CH3	осн ³	0	N
58	-CH ₂ -CH=CH ₂	6-NO ₂	CH ₃	OCH ³	0	СН
59	-CH ₂ -CH=CH ₂	6-NO ₂	осн ₃	осн ₃	0	СН
60	-CH ₂ -CH=CH ₂	6-NO ₂	осн ₃	оснз	0	N
61	-сн ₂ -сн=сн-сн ₃	6-NO ₂	осн ₃	оснз	0	N
62	-сн ₂ -сн=сн-сн ₃	6-NO ₂	OCH ₃	OCH ₃	0	СН
63	-CH ₂ -CH=CH-CH ₃	6-NO ₂	оснз	CH3	0	СН
64	-CH ₂ -CH=CH-CH ₃	6-NO ₂	осн ₃	CH ₃	0	N
65	-сн ₂ -осн ₃	6-NO ₂	осн3	CH ₃	0	N
66	-сн ₂ -осн ₃	6-NO ₂	осн ₃	сн3	0	СН
67	-CH ₂ -CH ₂ -OC ₂ H ₅	6-NO ₂	осн ₃	CH ₃	0	СН
68	-CH ₂ -CH ₂ -OC ₂ H ₅	6-NO ₂	OCH ₃	CH ₃	0	N
69	сн ₃ -сн ₂ -с=сн ₂	6-NO ₂	осн ₃	CH ₃	0	N
70	СH ₂ -С=СH ₂	6-NO ₂	осн3	Сн3	0	СН
71	-CH ₂ -CH=CH ₂	6-COOCH_	осн ₃	CH ₃	0	СН
72	-CH ₂ -CH=CH ₂	6-соосн	осн ₃	CH3	0	N
73	-CH ₂ -CH=CH ₂	6-COOCH	OCH ₃	OCH ₃	0	N
74	-CH ₂ -CH=CH ₂	6-соосн.	OCH ₃	OCH ₃	0	СН

Tabelle 3: (Fortsetzung)

Nr.	A	R ₁	R ₃	R ₄	x.	E	phys. Daten
75	-CH2CH=CH2	5 - C1	CH ₃	OCH ₃	0	N	
76	-CH ₂ CH=CH ₂	5-C1	CH ₃	осн ₃	0	СН	
77	-CH ₂ CH=CH ₂	5-C1	осн ₃	OCH ₃	0	N	
78	-CH2CH=CH2	5 - C1	осн ₃	OCH ₃	0	N	
79	-CH ₂ CH=CH ₂	5 - C1	с ₂ н ₅	осн ₃	0	N	
80	-сн ₂ -с=сн ₂	5-C1	сн3	OCH ₃	0	N	
81	Сн ₃ -сн ₂ -с=сн ₂	5 - C1	CH ₃	осн ₃	0	СН	
82	-CH ₂ CH=CH ₂	5-Br	CH3	och3	0	СН	
83	-CH ₂ CH=CH ₂	5-Br	CH3	OCH ₃	0	N	Smp. 190-191°
84	-CH ₂ CH=CH ₂	5-Br	с ₂ н ₅	CH ₃	0	N	
85	СН-3 -СН-С=СН ₂	5-Br	CH ₃	OCH3	0	N	
86	СН ₃ -СН-С=СН ₂	5-Br	OCH ₃	OCH ³	0	N	
87	СН ₃ -СН-С=СН ₂	5-Br	CH ₃	OCH ₃	0	CH	
88	-сн ₂ -осн ₃	5-Br	сн ₃	OCH ₃	0	CH	
89	-сн ₂ -осн ₃	5-Br	CH ₃	OCH ₃	0	N	
90	-сн ₂ -сн=сн ₂	5-F	СН3	OCH ₃	0	N	Smp.159-161°
91	-сн ₂ -сн=сн ₂	5-F	CH ₃	OCH ₃	0	CH	Smp.200-201°
92	-сн ₂ -сн=сн ₂	5 - F	осн ₃	C2H5	0	N	
93	-CH ₂ -CH=CH ₂	5-F	OCH ₃	осн3	0	СН	Smp.162-164°

Tabelle 3 : (Fortsetzung)

Nr.	A	R ₁	R ₃	R ₄	х	E	phys. Daten
94	-CH2-CH-CCH3	5 - F	CH ₃	осн3	0	N	
95	-CH ₂ -CH=CCH ₃	5 - F	CH3	OCH ₃	o	СН	·
96	CH ₃ -CH ₂ -C=CH ₂	5 - F	сн3	осн ₃	0	СН	
97	СH ₃ -СH ₂ -С=СH ₂	5 - F	сн3	OCH ₃	0	N	
98	СH ₂ -С=СH ₂	5-CH CH ₃	CH3	OCH ₃	o	N	
99	СH ₂ -C=CH ₂	5-CH CH ₃	CH3	осн3	o	СН	-
100	-CH ₂ -CH=CCH ₃		сн ₃	осн3	0	СН	
101	-CH2-CH=CCH3	1 2 014	СНЗ	осн ₃	0	N	
102	-CH ₂ -CH=CH ₂	5-CH CH ₃	CH ₃	осн ³	0	N	Smp. 259-260°.
103	-CH ₂ -CH=CH ₂	5-CH CH ₃	CH ₃	ocH ³	0	СН	Smp. 139-140°
104	4 -CH ₂ -CH=CH ₂	5-CH CH ₃	1 2245	осн3	0	N	
10	5 -CH ₂ -CH=CH ₂	5-CH CH ₃	осна	осн3	0	N	Smp. 219-220°

Tabelle 3: (Fortsetzung)

Nr.	A	R ₁	R ₃	R ₄	х	E	phys. Daten
106	-сн ₂ -сн ₂ -осн ₃	5-CH CH ₃	СНЗ	осн ₃	0	N	
107	-сн ₂ -сн ₂ -осн ₃	5-CH CH ₃	CH ₃	осн3	0	СН	
108	-сн ₂ -сн ₂ -осн ₃	5-CH ₃	CH ₃	OCH ₃	0	СН	
109	-сн ₂ -сн ₂ -осн ₃	5-CH ₃	СН ₃	осн ₃	0	N	
110	-сн ₂ -сн ₂ -осн ₃	5-CH ₃	CH ₃	C1	0	СН	
111	-СH ₂ -СH ₂ -ОСН ₃	5-CH ₃	осн ₃	C1	0	СН	
112	-СH ₂ -СH=СH ₂	5-CH ₃	CH ₃	осн ₃	0	N	Smp. 158-162°
113	-CH ₂ -CH=CH ₂	. 5-СН _З	CH ₃	осн ₃	0	N	
114	-CH ₂ -CH=CH ₂	5-CH ₃	С ₂ н ₅	осн3	0	N	
115	-CH ₂ -CH=CH ₂	5-CH ₃	осн ₃	OCH ₃	0	N	Smp. 160-165°
116	-CH ₂ -CH=CH ₂	5-CH ₃	осн ₃	осн3	0	СН	
117	-CH ₂ -CH=CH-CH ₃	5-CH ₃	осн ₃	осн ₃	0	СН	
118	-CH ₂ -CH=CH-CH ₃	5-CH ₃	CH3	OCH ₃	0	Сн	Smp. 179-182°
119	-сн ₂ -сн=сн-сн ₃	5-CH ₃	CH ₃	осн ₃	0	N	
120	-сн ₂ -сн=сн-сн ₃	5-no ₂	CH3	OCH3	0	N	
121	-сн ₂ -сн=сн-сн ₃	5-no ₂	CH ₃	осн ₃	0	СН	
122	-сн ₂ -сн=сн-сн ₃	5-NO ₂	с ₂ н ₅	осн3	0	· N	
123	-CH ₂ -CH=CH-CH ₃	5-NO ₂	осн ₃	OCH ₃	0	N	
124	-CH ₂ -CH=CH ₂	5-no ₂	осн ₃	осн ₃	0	N	
125	-CH ₂ -CH=CH ₂	5-NO ₂	CH ₃	OCH ₃	. 0	N	
126	-CH ₂ -CH=CH ₂	5-NO ₂	CH ₃	OCH3	0	СН	

Tabelle 3: (Fortsetzung)

Nr.	A	R_{1}	R ₃	R ₄	х	E	phys. Daten
127	-CH ₂ -SCH ₃	5-NO ₂	CH ₃	осн ₃	0	СН	
128	-CH ₂ -SCH ₃	5-NO ₂	CH ₃	осн ₃	0	N	
129	-сн ₂ -scн ₃	5-NO ₂	осн ₃	OCH ₃	0	N	
130	-сн ₂ -scн ₃	5-NO ₂	осн ₃	OCH ₃	0	СН	
131	-CH ₂ -CH=CH ₃	5-0CH ₃	CH ₃	OCH ₃	0	N	Smp. 142-143°
132	-сн ₂ -сн=сн ₃	5-0CH ₃	CH ₃	OCH ₃	0	CH	Smp. 138-139°
133	-CH ₂ -CH=CH ₃	5-0CH ₃	осн3	OCH ₃	0	СН	
134	-CH ₂ -CH=CH ₃	5-0CH ₃	OCH ₃	OCH ₃	0	N	
135	-CH ₂ -CH=CH ₃	5-0CH ₃	осн ₃	с ₂ н ₅	0	N	
136	-сн ₂ -с=сн ₂	5-0CH ₃	OCH ₃	CH ₃	0	N	
137	сн ₃ -сн ₂ -с=сн ₂	5-0CH ₃	och ₃	CH ₃	0	СН	
138	-CH ₂ -C=CH ₂	5-0CH ₃	осн3	och ₃	0	N	
139	-CH ₂ -CH=CH-CH ₃	5-0CH ₃	осн ₃	CH3	0	N	
140	-CH ₂ -CH=CH-CH ₃	5-0CH ₃	осн ₃	CH ₃	0	СН	
141	-сн ₂ -сн-сн-сн ₃	5-0CH ₃	осн ³	OCH ₃	0	СН	
142	-CH ₂ -CH=CH-CH ₃	5-0CH ₃	OCH ₃	OCH ₃	0	N	
143	3 -сн ₂ -осн ₃	5-0CH ₃	осн ₃	OCH ₃	0	N	
144	-сн ₂ -осн ₃	5-0CH ₃	CH ³	осн ₃	0	N	,
14!	5 -сн ₂ -осн ₃	5-0CH ₃	CH ₃	осн ₃	0	СН	
140	6 -сн ₂ -осн ₃	5-0CH	C ₂ H ₅	осн ₃	0	N	
14	7 -CH ₂ -CH ₂ -SCH ₃	5-OCH.	CH ₃	OCH ₃	0	N	

Tabelle 3: (Fortsetzung)

Nr.	A	R ₁	R ₃	R ₄	х	E
148	-сн ₂ -сн ₂ -sсн ₃	5-0CH ₃	CH ₃	оснз	0	СН
149	-сн ₂ -сн ₂ -sсн ₃	5-0CH ₃	осн ₃	осн ₃	0	N
150	-сн ₂ -сн=сн ₂	5-CON CH ₃	сн ₃	осн3	0	N
151	-сн ₂ -сн=сн ₂	5-CON CH ₃	CH3	осн3	0	СН
152	СН ₂ -С=СН ₂	5-CON CH ₃	CH ₃	осн3	0	N
153	СH ₂ -С=СH ₂	5-CON CH ₃	CH ₃	осн ₃	0	СН
154	СН ₃ -СН ₂ -С=СН ₂	5-соосн ₃	сн3	осн3	0	СН
155	СH ₂ -С=СH ₂	5-COOCH ₃	CH ₃	осн _З	o	N
156	-CH ₂ -CH=CH ₂	5-COOCH ₃	CH3	оснз	0	N
157	-CH ₂ -CH=CH ₂	5-COOCH ₃	CH ₃	0СН3	0	СН
158	-сн ₂ -сн=сн ₂	5-COOCH ₃	осн ₃	осн	0	N
159	-CH ₂ -CH=CH ₂	5-соосн ₃	осн3	осн ₃	0	СН
160	-CH ₂ -OC ₂ H ₅	5-COOCH ₃	осн ₃	СНЗ	0	N
161	-CH ₂ -OC ₂ H ₅	5-соосн ₃	осн ₃	СН _З	0	N
162	-сн ₂ -с=сн ₂ ci	5-CH ₃	осн	CH ₃	0	N
163	-СH ₂ -С=СН ₂	5-CH ₃	осн ₃	CH ³	0	СН
164	С1 -сн ₂ -с=сн-с1	5-no ₂	осн3	CH ₃	0	Сн

Tabelle 3: (Fortsetzung)

Nr.	A	R ₁	R ₃	R ₄	Х	E
165	C1 -CH ₂ -C=CH-C1	5-NO ₂	осн ₃	СН3	0	N
166	C1 -CH ₂ -C=CH-C1	5-Br	осн3	сн3	0	N
167	С1 -сн ₂ -с=сн-с1	5-Br	осн ₃	сн3	0	СН
168	С1 -СН ₂ -С=СН-С1	5 - C1	осн3	CH ₃	0	N
169	C1 -CH ₂ -C=CH ₂	5-C1	сн ₃	och ³	0	СН
170	-CH ₂ -CH=CC1	5 - C1	сн3	осн ₃	0	N
171	-CH ₂ -CH=C CH ₃	5-C1	CH ₃	осн3	0	СН
172	-CH ₂ -CH=C C1	5-CH CH ₃	CH ₃	осн ₃	О	СН
173	-CH ₂ -CH=CC1	5-CH CH ₃	CH3	осн3	0	N
174	-CH ₂ -C=CH ₂	3-CH ₃	CH ₃	оснз	0	N
175	C1 -CH ₂ -C=CH ₂	3-CH ₃	сн ₃	осн ₃	0	СН
176	C1 -CH ₂ -C=CH ₂	6-CH ₃	CH ₃	och ₃	0	N
177	C1 -CH ₂ -C=CH ₂	6-CH ₃	CH ₃	och ₃	0	СН
178	C1 -CH ₂ -C=CH-C1	6-0CH ₃	CH ₃	осн ₃	0	СН

Tabelle 3: (Fortsetzung)

Nr.	A	R ₁	R ₃	·R ₄ · · ·	x	E	phys. Daten
179	C1 -CH ₂ -C=CH-C1	6-осн ₃	CH ₃	осн ₃	0	N	
180	-CH ₂ -CH=C C1	5OCH ₃	CH ₃	осн ³	0	N _.	
181	-CH ₂ -CH=C C1	5-0CH ₃	сн3.	осн3	. 0	CH	
182	C1 -CH ₂ -C=CH ₂	6-C1	СН3	OCH ₃	0	N	
183	С1 -CH ₂ -C=CH ₂	6 - C1	CH ₃	осн ₃	0	СН	
184	-сн ₂ -сн=сн ₂	3-NO ₂	CH3	осн ₃	0	СН	
185	-сн ₂ -сн=сн ₂	3-NO ₂	CH ₃	OCH ₃	0	N	
186	-сн ₂ -сн=сн ₂	3-NO ₂	с ₂ н ₅	OCH ₃	0	N	
187	-сн ₂ -сн=сн ₂	3-NO ₂	OCH ₃	осн ₃	0	N	
188	-CH ₂ -C=CH ₂ CH ₃	3-NO ₂	CH3	och3	0	N	
189	-CH ₂ -C=CH ₂	3-NO ₂	CH3	OCH ₃	0	СН	
190	-сн ₂ -с=сн ₂ сн ₃	3-NO ₂	осн3	осн3	0	N	
191	-CH ₂ -C=CH ₂	3-NO ₂	оснз	OCH ₃	0	СН	
192	C1 -CH ₂ -CH=C-CH ₃	3-NO ₂	och3	OCH ₃	0	СН	
193	C1 -CH ₂ -CH=C-CH ₃	3-NO ₂	осн 3	сн3	0	CH	
194	С1 -СH ₂ -СH=С-СН ₃	3-NO ₂	OCH ₃	CH ₃	0	N	
195	-CH ₂ -CH=CH ₂	3-CH ₃	осн ₃	CH ₃	0	N	Smp. 255-256°

Tabelle 3: (Fortsetzung)

Nr.	A	R ₁	R ₃	R ₄	X	E	phys. Daten
196	-сн ₂ -сн=сн ₂	3-CH ₃	OCH ₃	CH ₃	0	CH	Smp. 163-164°
197	-сн ₂ -сн=сн ₂	3-CH ₃	с ₂ н ₅	CH ₃	0	N	
198	-сн ₂ -сн=сн ₂	3-CH ₃	осн ₃	CH ₃	0	N	Smp. 183-184°
199	-сн ₂ -сн=сн ₂	3-CH ₃	осн ³	CH ₃	0	СН	
200	-сн ₂ -сн=сн ₂	3-C1	OCH ₃	СН3 .	0	СН	· "
201	-сн ₂ -сн=сн ₂	3-C1	OCH ₃	CH ₃	0	N	
202	-сн ₂ -сн=сн ₂	3-C1	осн ₃	осн ₃	0	N	
203	-сн ₂ -сн=сн ₂	3 - C1	OCH3	осн ₃	0	CH	
204	СН ₃ -СН ₂ -С=СН ₂	3-C1	осн3	OCH3	0	N	
205	СН ₂ -С=СН ₂	3-C1	осн3	CH _{3.}	0	N	
206	CH ₂ -C=CH ₂	3-C1	осн ₃	CH ₃	0	CH	
207	-CH ₂ -CH=CH-CH ₃	3-C1	сн ₃	осн ₃	0	N	<u>.</u>
208	-CH ₂ -CH=CH-CH ₃	3-C1	сн ₃	осн3	0	СН	
209	сн ₃ -сн ₂ -с-сн ₂	3-0CH3	CH3	осн ₃	0	CH	
210	CH ₃ -CH ₂ -C=CH ₂	3-0CH ₃	CH ₃	осн ₃	0	N	·
211	-сн ₂ -сн=сн ₂	3-0CH ₃	CH ³	OCH3	0	N	
212	-CH ₂ -CH=CH ₂	3-0CH ₃	CH ³	оснз	0	СН	
213	-CH ₂ -CH=CH ₂	3-0CH ₃	осн ₃	осн _з	0	СН	
214	-сн ₂ -сн=сн ₂	3-0CH ₃	С ₂ н ₅	осн ³	0	N	
215	-CH ₂ -CH=CH ₂	3-0CH ₃	осн ₃	осн ₃	0	N	

				_		~ ~
Nr.	A	R ₃	R ₄	х	E	phys. Daten
301	СН ₃ -СН ₂ -С=СН ₂	сн ₃	CH ₃	0	N	Smp. 95-103°
302	СН ₃ -СН ₂ -С=СН ₂	CH ₃	осн ₃	О	N	Smp. 142-143°
303	СН ₃ -СН ₂ -С=СН ₂	осн3	осн ₃	0	N	Smp. 145-153°
304	СН ₃ -СН ₂ -С=СН ₂	OCH3	ос ₂ н ₅	ο .	N	
305	СН ₃ -СН ₂ -С=СН ₂	-сн ₂ -сн ₃	OCH ₃	0	N	Smp. 150-152°
306	СН ₃ -СН ₂ -С=СН ₂	-сн ₂ -сн ₃	CH ₃	0	N	Smp. 129-130°
307	СН ₃ -СН ₂ -С=СН ₂	C1	осн ₃	o	N	
308	СН ₃ -СН ₂ -С=СН ₂	-OCH(CH ₃) ₂	осн ₃	0	N	
309	СН ₃ -СН ₂ -С=СН ₂	-осн(сн ₃) ₂	осн ₃	0	N	
310	СН ₃ -СН ₂ -С=СН ₂	-осн(сн ₃) ₂	CH3	0	N	
311	сн ₃ -сн ₂ -с=сн ₂	оснз	sch ₃	0	N	
312	сн ₃ -сн ₂ -с=сн ₂	oc ₂ H ₅	ос ₂ н ₅	o	N	Smp. 118-120°
313	сн ₃ -сн ₂ -с=сн ₂	осн ₃	-сн ₂ осн ₃	o	N	

Tabelle 4: (Fortsetzung)

Nr.	A	R ₃	R ₄ .	x	E	phys. Daten
314	СН ₃ -СН ₂ -С=СН ₂	сн ₂ с1	осн ₃	0	N	
315	сн ₃ -сн ₂ -с=сн ₂	сн ₂ ғ	осн ₃	0	N	
316	СН ₃ -СН ₂ -С=СН ₂	сн ₃	осн3	o	СН	Smp.172-177°
317	СН ₃ -СН ₂ -С=СН ₂	осн ₃	осн ₃	0	CH	
318	сн ₃ -сн ₂ -с=сн ₂	сн ₃	CH ₃	0	СН	
319	сн ₃ -сн ₂ -с=сн ₂	С ₂ н ₅	оснз	0	СН	
320	сн ₃ -сн ₂ -с=сн ₂	осн3	C1	0	CH	Smp.179-180°
321	сн ₃ -сн ₂ -с=сн ₂	сн ³	C1	0	СН	
322	СH ₂ -С=СH ₂	CF ₃	осн ₃	0-	Сн	
323	СН ₂ -С=СН ₂	-сн ₂ -осн ₃	och ₃	0	CH	
324	сн ₃ -сн ₂ -с=сн ₂	Br	OCH ₃	0	СН	
325	СН ₃ -СН ₂ -С=СН ₂	Br	CH ₃	0	СН	
326	СН ₃ -СН ₂ -С=СН ₂	осн3	sch3	0	CH	
327	СН ₃ -СН ₂ -С=СН ₂	CH ₃	sch ₃	0	СН	
328	Сн ₂ -с=сн ₂	осн3	oc ₂ H ₅	o	СН	

Tabelle 4: (Fortsetzung)

Nr.	A	R ₃	R ₄	x	E	phys. Daten
329	-сн ₂ -сн=сн-сн ₃	CH ₃	осн ₃	0	N	Smp.163-164°
330	-CH ₂ -CH=CH-CH ₃	сн ₃	CH ₃	0	· N	
331	-сн ₂ -сн=сн-сн ₃	с ₂ н ₅	осн ₃	0	N	Smp.139-140°
332	-CH ₂ -CH=CH-CH ₃	С ₂ Н ₅ .	СН3	0	N	Smp.148-151°
333	-сн ₂ -сн-сн-сн ₃	осн ₃	OCH ₃	0	N	Smp.148-149°
_334	-сн ₂ -сн-сн-сн ₃	осн ₃	ос ₂ н ₅	0	N	·
335	-сн ₂ -сн-сн-сн ₃	^{ОС} 2 ^Н 5	oc ₂ H ₅	0	N	
336	-CH ₂ -CH=CH-CH ₃	-сн ₂ -осн ₃	осн ₃	0	N	
337	-CH ₂ -CH=CH-CH ₃	Сн3	OCH ₃	0	СН	Smp.185-186°
338	-сн ₂ -сн-сн-сн ₃	OCH ₃	осн ₃	0	СН	
339	-сн ₂ -сн-сн-сн ₃	CH3	CH3	0	CH	
340	-CH ₂ -CH=CH-CH ₃	-сн ₂ -осн ₃	осн3	0	СН	
341	-CH ₂ -CH=CH-CH ₃	CH ₃	C1	0	СН	
342	-CH ₂ -CH=CH-CH ₃	OCH ³	C1	0	СН	·
343	-CH ₂ -CH=CH-CG ₃	осн ₃	ос ₂ н ₅	0	CH	
344	-CH ₂ -CH=CCH ₃ CH ₃	CH3	оснз	О	N	
345	-CH ₂ -CH=CCH ₃	CH ₃	CH ₃	0	N	
346	-сн ₂ -сн-с сн ₃	С ₂ н ₅	CH3	0	N	
347	-CH ₂ -CH=CCH ₃	с ₂ н ₅	осн3	0	N	

Tabelle 4: (Fortsetzung)

Nr.	A	R ₃	R ₄	x	E
348	-CH ₂ -CH=CCH ₃	осн ₃	осн ₃	0	N
349	-CH ₂ -CH=CCH ₃	оснз	ос ₂ н ₅	0	N
350	-CH ₂ -CH=CCH ₃	^{ос} 2 ^н 5	ос ₂ н ₅	0	N
351	-CH ₂ -CH=CCH ₃ CH ₃	-сн ₂ -осн ₃	оснз	0	N
352	-CH ₂ -CH=CCH ₃	CH3	оснз	0	СН
353	-CH ₂ -CH=CCH ₃	осн ₃	оснз	0	CH
354	-CH ₂ -CH=CCH ₃ CH ₃	CH3	сн _З	0	СН
355	-CH ₂ -CH=CCH ₃	och ₃	C1	0	СН
356	-CH ₂ -CH=CCH ₃ CH ₃	сн3	C1	0	СН
357	-CH ₂ -CH=CCH ₃ CH ₃	OCH3	ос ₂ н ₅	0	СН
358	C1 -CH ₂ -C=CH ₂	CH ₃	осн ₃	0	N
359	C1 -CH ₂ -C=CH ₂	CH3	CH ₃	0	N

Tabelle 4: (Fortsetzung)

				· ·		
Nr.	A	R ₃	R ₄	X	E	phys. Daten
360	C1 -CH ₂ -C=CH ₂	с ₂ н ₅	CH.	0	N	
361	C1 -CH ₂ -C=CH ₂	с ₂ н ₅	осн3	0	N	
362	C1 -CH ₂ -C=CH ₂	OCH ₃	осн ₃	0	N	
363	C1 -CH ₂ -C=CH ₂	OCH ₃	ос ₂ н ₅	0	N	
364	C1 -CH ₂ -C=CH ₂	ос ₂ н ₅	oc ₂ H ₅	0	N	
365	C1 -CH ₂ -C=CH ₂	-сн ₂ -осн ₃	осн ₃	0	N	
366	C1 -CH ₂ -C=CH ₂	CH ₃	осн3	0	CH	
367	-CH ₂ -C=CH ₂	осн ³	осн ₃	0	СН	•
368	C1 -CH ₂ -C=CH ₂	СН _З	CH ₃	0	СН	
369	C1 -CH ₂ -C=CH ₂	OCH ₃	C1	0	CH	
370	C1 -CH ₂ -C=CH ₂	СН _З	C1	0	СН	
371	C1 -CH ₂ -C=CH ₂	OC ₂ H ₅	OCH ₃	0	СН	
372	C1 -CH ₂ -C=CH ₂	-сн ₂ -осн ₃	och ₃	0	СН	
373	-CH ₂ -OCH ₃	CH ₃	OCH ₃	0	N	Smp.:- 155-157°
374	-сн ₂ -осн ₃	осн ₃	осн ₃	0	N	
375	-сн ₂ -осн ₃	С ₂ н ₅	OCH ₃	0	N	
376	-сн ₂ -осн ₃	С ₂ Н ₅	CH ₃	0	N	

Tabelle 4: (Fortsetzung)

Nr.	A	R ₃	R ₄	X	E	phys. Daten
377	-сн ₂ -осн ₃	OCH ³	OCH ₃	0	N	
378	-CH ₂ -OCH ₃	OCH ₃	OC ₂ H ₅	0	N	
379	-CH ₂ -OCH ₃	oc ₂ H ₅	OC ₂ H ₅	0	N	
380	-CH ₂ -OCH ₃	-CH ₂ -OCH ₃	OCH ₃	0	N	
381	-CH ₂ -OCH ₃	OCH ₃	SCH ₃	0	N	
382	-CH ₂ -OCH ₃	осн ₃	CH ₃	0	СН	Smp.: 168-175°
383	-CH ₂ -ОСН ₃	осн ₃	осн ₃	0	СН	
384	-CH ₂ -OCH ₃	СН ₃	CH ₃	0	СН	
385	-сн_2-осн_3	CH ₃	C1	0	СН	Smp.: 137-143°
386	-CH ₂ -OCH ₃	осн ₃	C1	0	CH	
387	-CH ₂ -ОСН ₃	с ₂ н ₅	осн3	0	CH	
388	-CH ₂ -OCH ₃	oc ₂ H ₅	осн ₃	0	СН	
389	C1 -CH ₂ -C=CH ₂	с ₂ н ₅	OCH3	o	CH	
390	-CH ₂ -CH=CCH ₃ CH ₃	с ₂ н ₅	осн ₃	0	СН	
391	-сн ₂ -сн=сн-сн ₃	с ₂ н ₅	OCH ₃	0	СН	
392	-CH ₂ -S-CH ₃	CH ₃	осн ₃	0	N	
393	-сн ₂ -s-сн ₃	CH ₃	CH ₃	0	N	
394	-CH ₂ -S-CH ₃	C ₂ H ₅	CH ₃	0	N	
295	-CH ₂ -S-CH ₃ .	С ₂ Н ₅	осн3	0	N	
396	-CH ₂ -S-CH ₃	осн ₃	осн ³	0	N	
397	-CH ₂ -S-CH ₃	осн3	ос ₂ н ₅	0	N	
398	-CH ₂ -S-CH ₃	-сн ₂ -осн ₃	осн ₃	0	N	

Tabelle 4: (Fortsetzung)

Nr.	A	R ₃	R ₄	х	E	phys. Daten
399	-сн ₂ -s-сн ₃	сн ₃	OCH ₃	0	СН	
400	-CH ₂ -S-CH ₃	осн3	OCH ³	0	СН	
401	-сн ₂ -s-сн ₃	CH ₃	CH ₃	0	СН	·
402	-CH ₂ -S-CH ₃	с ₂ н ₅	OCH3	0	СН	
403	-сн ₂ -s-сн ₃	осн ₃	C1	0	СН	
404	-сн ₂ -s-сн ₃	СН _З	C1	0	СН	
405	-CH ₂ -S-CH ₃	осн3	oc ₂ H ₅	0	СН	
406	-сн ₂ -сн ₂ -ос ₂ н ₅	Сн3	OCH ₃	0	N	
407	-сн ₂ -сн ₂ -ос ₂ н ₅	CH3	CH ₃	0	N	
408	-сн ₂ -сн ₂ -ос ₂ н ₅	С ₂ н ₅	CH ₃	0	N	
409	-сн ₂ -сн ₂ -ос ₂ н ₅	с ₂ н ₅	OCH ₃	0	N	
410	-сн ₂ -сн ₂ -ос ₂ н ₅	осн3	OCH ₃	0	N	
411	-сн ₂ -сн ₂ -ос ₂ н ₅	СН3	осн ₃	0	СН	
412	-сн ₂ -сн ₂ -ос ₂ н ₅	OCH ³	осн3	0	СН	
413	-сн ₂ -сн ₂ -ос ₂ н ₅	осн ₃	C1	0	СН	Smp. 166-168°
414	-сн ₂ -сн ₂ -ос ₂ н ₅	CH ₃	C1 -	0	СН	
415	-Сн ₂ -Сн=Сн ₂	CH3	с ₂ н ₅	S	N	
416	-СH ₂ -СH=СH ₂	OCH ₃	с ₂ н ₅	s	N	
417	-CH ₂ -CH=CH ₂	СН3	OCH ₃	S	СН	
418	-CH ₂ -CH=CH ₂	осн ₃	осн ₃	S	СН	
419	-CH ₂ -CH=CH ₂	CH ₃	OCH ₃	so	N	
420	-CH ₂ -CH=CH ₂	осн ₃	осн ₃	SO	N	
421	-CH ₂ -CH=CH ₂	осн ₃	с ₂ н ₅	so	N	

Tabelle 4: (Fortsetzung)

Nr.	A	R ₃	R ₄	X	E
422	-сн ₂ -сн=сн ₂	OCH ₃	осн ₃	so	CH
423	-CH ₂ -CH=CH ₂	СН _З	осн3	so	СН
424	-сн ₂ -сн=сн ₂	CH ₃	OCH ₃	so ₂	N ,
425	-сн ₂ -сн=сн ₂	OCH ₃	оснз	so ₂	N
426	-сн ₂ -сн=сн ₂	OCH ₃	OCH ₃	so ₂	СН
427	-сн ₂ -сн=сн ₂	CH ₃	осн ³	so ₂	СН
428	-сн ₂ -сн=сн-сн ₃	сн ₃	och ³	so ₂	N
429	-CH ₂ -CH=CH-CH ₃	сн ₃	оснз	so ₂	СН
430	-сн ₂ -сн=сн-сн ₃	CH3	осн ₃	so	СН
431	-сн ₂ -сн=сн-сн ₃	CH ₃	OCH ₃	so	N
432	-сн ₂ -so-сн ₃	CH ₃	осн ₃	0	N
433	-сн ₂ -so-сн ₃	CH3	осн ₃	0	СН
434	-сн ₂ -so-сн ₃	осн3	OCH ³	0	N
435	-сн ₂ -so-сн ₃	осн ₃	осн ₃	0	СН
436	-CH ₂ -SO ₂ -CH ₃	осн3	осн3	0	СН
437	-CH ₂ -SO ₂ -CH ₃	ся ³	OCH ₃	0	СН
438	-CH ₂ -SO ₂ -CH ₃	CH ₃	СН3	0	СН
439	-CH ₂ -SO ₂ -CH ₃	CH ³	осн ₃	0	N
440	-сн ₂ -so ₂ -сн ₃	осн3	осн3	0	N
441	-сн ₂ -сн ₂ -so-сн ₃	осн ₃	OCH ₃	0	N
442	-сн ₂ -сн ₂ -sо-сн ₃	осн3	~ CH _{3 ::::}	0	N
443	-сн ₂ -сн ₂ -so-сн ₃	осн3	Снз	0	СН

Tabelle 4: (Fortsetzung)

Nr.	A	R ₃	R ₄	х	E
444	-сн ₂ -сн ₂ -so ₂ -сн ₃	осн ₃	CH ³	0	СН
445	-сн ₂ -сн ₂ -sо ₂ -сн ₃	осн ₃	CH ₃	0	N
446	$-\text{CH}_2$ - CH_2 - SO_2 - CH_3	CH ₃	OCH ₃	0	N
447	СН ₃ -СН ₂ -С=СН ₂	Сн ₃	OCH ₃	s	N
448	СН ₃ -СН ₂ -С=СН ₂	СН _З	OCH ₃	S	СН
449	-сн ₂ -сн=с сн ₃	СН3	осн3	S	СН
450	-CH ₂ -CH=CCH ₃	снз	осн ₃	S	N
451	-CH ₂ -CH=CH ₂ -CH ₃	CH ₃	осн ₃	S	N
452	-CH ₂ -CH=CH ₂ -CH ₃	CH ₃	OCH ₃	S	СН
453	-сн ₂ -сн ₂ -осн ₃	CH ₃	осн3	S	СН
454	-сн ₂ -сн ₂ -осн ₃	CH ₃	OCH ₃	S	N
455	-(CH ₂) ₂ -CH=CH ₂	CH ₃	OCH ₃	0	N
456	-(CH ₂) ₂ -CH=CH ₂	CH ₃	OCH ₃	0	CH
457	-(CH ₂) ₂ -CH=CH ₂	CH ₃	CH ₃	0	N
458	-(CH ₂) ₂ -CH=CH ₂	CH ₃	CH ₃	0	СН
459	-(CH ₂) ₃ -CH=CH ₂	CH ₃	OCH ₃	0	N
460	-(сн ₂) ₃ -сн=сн ₂	CH3	осн ₃	0	СН
461	-CH ^{CH} 3	СН3	осн ₃	0	N

Tabelle 4: (Fortsetzung)

Nr.	A	R ₃	R ₄	x	E	phys. Daten
462	-CH CH=CH ₂	сн3	осн ₃	0	СН	
463	-CH ₂ -OC ₂ H ₅	CH3	осн3	0	СН	
464	-сн ₂ -ос ₂ н ₅	CH ₃	осн ₃	0	N	
465	-CH ₂ -OC ₂ H ₅	с ₂ н ₅	осн ₃	0	N	
466	-CH ₂ -OC ₂ H ₅	CH ₃	СН3	0	N	
467	-сн ₂ -ос ₂ н ₅	сн ³	CH ₃	0	CH	
468	-сн ₂ -сн ₂ -осн ₃	СНЗ	CH ₃	0	СН	t gree
469	-сн ₂ -сн ₂ -осн ₃	CH ₃	CH ₃	0	N	
470	-сн ₂ -сн ₂ -осн ₃	CH ₃	OCH ₃	0	N	Smp. 134-138°
471	-сн ₂ -сн ₂ -осн ₃	, сн ³	осн3	0	Сн	Smp. 160-162°
472	-CH ₂ -CH ₂ -SCH ₃	CH ₃	осн ₃	0	СН	-
473	-CH ₂ -CH ₂ -SCH ₃	CH ₃	осн3	0	N	
474	С1 -CH ₂ -C=CH-C1	CH ³	осн3	0	N	
475	C1 -CH ₂ -C=CH-C1	CH ₃	осн3	0	СН	
476	С1 -СH ₂ -СН=С-СН ₃	CH ₃	осн ₃	0	СН	
477	C1 -CH ₂ -CH=C-CH ₃	CH3	осн ₃	0	N	
479	-CH ₂ -CH=C C1	CH ₃	осн ₃	0	Ñ	
479	-CH ₂ -CH=C C1	CH ₃	осн ₃	0	СН	

Tabelle 4: (Fortsetzung)

Nr.	Α .	R ₃	R ₄	х	E	phys. Daten
480	-сн ₂ -сн ₂ -о-сн ₂ -сн=сн ₂	CH ₃	OCH ₃	0	СН	
481	-CH ₂ -CH ₂ -O-CH ₂ -CH=CH ₂		осн ₃	0	N	
482	-CC1=CC1 ₂	CH3	осн ₃	0	N	
483	-CC1=CHC1	OCH ₃	осн ₃	0	СН	
484	-CC1=CC1 ₂	осн3	осн ₃	0	N	
485	-CC1=CC1 ₂	CH ₃	осн ₃	0	СН	
486	-CC1=CC1 ₂	осн ₃	осн3	0	СН	
487	-cci=cci ₂	CH ₃	C1	0	СН	
488	-cc1=cc1 ₂	осн ₃	C1	0	N	
489	-CF=CF ₂	осн ₃	C1	0.	N	
490	-CF=CF ₂	CH ₃	Cl	0	СН	
491	-CH=CC1 ₂	OCH3	осн ₃	0	N	
492	-CH=CC1 ₂	CH ₃	осн3	0	СН	
493	-CH=CC1 ₂	осн ₃	осн ₃	0	СН	
494	-CH=CC1 ₂	с ₂ н ₅	осн3	0	N	
495	-CF=CF ₂	с ₂ н ₅	осн ₃	0	N	
496	-CC1=CHC1	OCH ₃	осн ₃	S	N	
497	-CC1=CHC1	CH3	оснз	0	N	Smp. 169-172°
498	-CC1=CHC1	C ₂ H ₅	осн3	0	N	
499	-CC1=CHC1	CH ₃	СНЗ	0	N	
500	-CC1=CHC1	осн ₃	C1	0	СН	Smp. 196-198°
501	-CC1=CHC1	осн3	OC ₂ H ₅	0	N	
502	-CC1=CHC1	осн ₃	OCH ₃	0	СН	

Tabelle 4: (Fortsetzung)

Nr.	A	R ₃	R ₄	х	E	phys. Daten
503	-CC1=CHC1	с ₂ н ₅	осн3	0	СН	
504	-CC1=CHC1	CH ₃	C1	0	СН	
505	-CC1=CHC1	CH3	осн ₃	s	СН	;:
506	-CC1=CHC1	осн3	осн3	s	СН	
507	-cf=cf ₂	снз	осн ₃	0	N	
508	-CF=CF ₂	осн ₃	осн ₃	0	N	
509	-CF=CF ₂	CH ₃	OCH ₃	0	СН	
510	-CF=CF ₂	осн ₃	OCH ³	0	СН	
511	-сн ₂ -сн=сн ₂	-CH(CH ₃) ₂	och3	0	СН	·
512	-CH ₂ -CH=CH ₂	осн 3	SC ₂ H ₅	0	CH	
513	-CH ₂ -CH=CH ₂	оснз	sc ₂ H ₅	0	N	
514	-CH ₂ -CH=CH ₂	осн ₃	-scн(сн ₃) ₂	0	N	
515	-CH ₂ -CH=CH ₂	C1	CH ₃	0	N	Smp. 128-130°
516	-CH ₂ -CH=CH ₂	CH ₃	Br	0	N	
517	-CH2-CH=CH2	CHF ₂	OCH ₃	0	N	
518	-CH ₂ -CH=CH ₂	CHF ₂	CH ₃	0	N	
519	-CH ₂ -CH=CH ₂	-CH2CF3	Cl	0	N	
520	-CH ₂ -CH=CH ₂	-CH ₂ CF ₃	OCH ₃	0	N	
521	-CH ₂ -CH=CH ₂	-CH ₂ CF ₃	CH ₃	0	N	
522	-CH ₂ -CH=CH ₂	oc ₂ H ₅	oc ₂ H ₅	0	N	Smp.138-142°
523	-CH ₂ -CH=CH ₂	oc ₂ H ₅	oc ₂ H ₅	0	СН	
524	-CH ₂ -CH=CH ₂	с ₂ н ₅	OCH ₃	0	N	Smp. 206°
525	-CH ₂ -CH=CH ₂	C2H5	oc ₂ H ₅	0	N	

Tabelle 4: (Fortsetzung)

Nr.	A	R ₃	R ₄	x	Ė	phys. Daten
526	-сн ₂ -сн=сн ₂	CH ₃	OC ₂ H ₅	0	N	Smp.129-131°
527	-CH ₂ -CH=CH ₂	СН ₃	CH ₃	0	СН	Smp. 180-182°
528	-CH ₂ -CH=CH ₂	СНЗ	OCH ₃	0	СН	Smp. 98-100°
529	-CH ₂ -CH=CH ₂	CH ₃	Br	0	N	
530	-CH ₂ -CH=CH ₂	CH ₃	H	0	N	
531	-CH ₂ -CH=CH ₂	с ₂ н ₅	C1	0	СН	
532	-CH ₂ -CH=CH ₂	CH ₃	C1	0	СН	Smp. 153-154°
533	-CH ₂ -CH=CH ₂	CH ₃	SCH ₃	0	СН	
534	-CH ₂ -CH=CH ₂	CH ₃	F	0	СН	
535	-CH ₂ -CH=CH ₂	CH3	Br	0	СН	
536	-CH ₂ -CH=CH ₂	с ₂ н ₅	OC ₂ H ₅	0	СН	
537	-CH ₂ -CH=CH ₂	C2H5	SCH ₃	0	СН	
538	-CH ₂ -CH=CH ₂	CF ₃	CH ₃	0	CH	
539	-CH ₂ -CH=CH ₂	CH ₂ C1	CH ₃	0	СН	
540	-CH ₂ -CH=CH ₂	CH ₂ C1	OCH ₃	0	СН	
541	-CH ₂ -CH=CH ₂	OCH ₃	C1	0	CH	Smp.173-179°
542	-CH ₂ -CH=CH ₂	C1	C1	0	СН	
543	-CH ₂ -CH=CH ₂	OCH ₃	SCH ₃	0	СН	
544	-CH ₂ -CH=CH ₂	OCH ₃	-осн(сн ₃) ₂	0	СН	
545	-CH ₂ -CH=CH ₂	CH ₂ F	осн ₃	0	СН	
546	-CH ₂ -CH=CH ₂	CH ₂ F	CH ₃	0	СН	
547	-CH ₂ -CH=CH ₂	CF ₃	осн ₃	0	СН	
548	-CH ₂ -CH=CH ₂	C ₂ H ₅	-OCH(CH ₃) ₂	0	N	

Tabelle 4: (Fortsetzung)

Nr.	A	Ъ	ъ	x	10	ahas Dana-
MI.	A	R ₃	R ₄	Α .	E	phys. Daten
549	-CH ₂ -CH=CH ₂	с ₂ н ₅	C1	0	N	
550	-сн ₂ -сн=сн ₂	с ₂ н ₅	SCH ₃	0	N	, ate
551	-сн ₂ -сн=сн ₂	С ₂ Н ₅	CH3	0	N	Smp. 128-131°
552	-сн ₂ -сн=сн ₂	С ₂ Н ₅	с ₂ н ₅	0	N	
553	-CH ₂ -CH=CH ₂	осн ₃	-och(ch ₃) ₂	0	N	Smp. 119-120°
554	-сн ₂ -сн=сн ₂	- осн ₃	-осн(сн ₃)-сн ₂ сн ₃	0	N	
555	-CH ₂ -CH=CH ₂	CH ₃	-CH(CH ₃) ₂	0	N	Smp. 96-98°
556	-CH ₂ -CH=CH ₂	-сн(сн ₃) ₂	C1	0	N	
557	-сн ₂ -сн=сн ₂	-CH(CH ₃) ₂	осн ₃	0	N	Smp. 124-128°
558	-сн ₂ -сн=сн ₂	-CH(CH ₃) ₂	ос ₂ н ₅	0	N	•
559	-сн ₂ -сн=сн ₂	-сн(сн ₃) ₂	SCH ₃	0	N	
560	-сн ₂ -сн=сн ₂	CH ₂ C1	Сн ₃	0	N	*
561	-CH ₂ -CH=CH ₂	CH ₂ C1	осн ₃	0	N	
562	-CH ₂ -CH=CH ₂	CH ₂ F	CH ₃	0	N	
563	-CH ₂ -CH=CH ₂	CH ₂ F	осн ₃	0	N	
564	-CH ₂ -CH=CH ₂	CH ₂ F	ос ₂ н ₅	0	N	
565	-сн ₂ -сн=сн ₂	-сн ₂ -осн ₃	с ₂ н ₅	0	N	
566	-сн ₂ -сн=сн ₂	-сн ₂ -sсн ₃	осн ₃	0	N	
567	-CH ₂ -CH=CH ₂	-сн ₂ -sсн ₃	СН ₃	0	N	
568	-сн ₂ -сн=сн ₂	-сн ₂ -sсн ₃	SCH ₃	0	N	
569	-CH ₂ -CH=CH ₂	-сн ₂ -sсн ₃	C1	0	N	
570	-CH ₂ -CH=CH ₂	-сн ₂ -sсн ₃	oc ₂ H ₅	0	N	
571	-CH ₂ -CH=CH ₂	SCH ₃	C1	0	N	

Tabelle 4: (Fortsetzung)

Nr.	A	R ₃	R ₄	x	E	phys. Daten
572	-сн ₂ -сн=сн ₂	SCH ₃	OCH ₃	0	N	
573	-сн ₂ -сн=сн ₂	SCH3	ос ₂ н ₅	0	N	
574	-сн ₂ -сн=сн ₂	sch ₃	-och CH3	0	N	
575	-CH ₂ -CH=CH ₂	-OCH(CH ₃) ₂	C1	0	N	
576	-CH2-CH=CH2	CF ₃	осн ₃	0	Й	
577	-CH ₂ -CH=CH ₂	CF ₃	CH ₃	0	N	
578	-сн ₂ -сн=сн ₂	CF ₃	oc ₂ н ₅	0	И	
579	-CH ₂ -CH=CH ₂	cc1 ₃	OCH ₃	0	N	
580	-сн ₂ -сн=сн ₂	cc1 ₃	SCH ₃	0	N	
581	-CH ₂ -CH=CH ₂	CH3	C1	0	N	Smp.128-130°
582	-CH ₂ -CH=CH ₂	OCH ³	C1	0	N	
583	-CH ₂ -CH=CH ₂	OCH ₃	F	0	N	·
584	-сн ₂ -сн=сн ₂	och ³	Br	0	N	
585	-CH ₂ -CH=CH ₂	CH3	F	0	N	
586	-CH ₂ -CH=CH ₂	OCH3	осн ₃	0	СН	•
587	-CH ₂ -CH=CH ₂	CH3	CH ₃	0	N	Smp.139.141°
588	-Сн ₂ -Сн=Сн ₂	осн3	OC ₂ H ₅	0	N	
589	-CH ₂ -CH=CH ₂	осн3	oc ₂ H ₅	0	СН	
590	-CH ₂ -CH=CH ₂	CH ₂ OCH ₃	OCH ₃	0	СН	
591	-сн ₂ -сн=сн ₂	CH ₂ OCH ₃	OCH ₃	0	N	
592	÷CH ₂ −CH=CH ₂	C2H5	OCH ₃	0	СН	

Tabelle 4: (Fortsetzung)

Nr.	A	R ₃	R ₄	х	E	phys. Daten
593	-сн ₂ -сн=сн ₂	CH ₂ OCH ₃	CH ₃	0	N	
594	-CH ₂ -CH=CH ₂	CH ₃	осн ₃	s	N	
595	-CH ₂ -CH=CH ₂	осн ₃	OCH ₃	0.	N	Smp. 148-149°
596	-CH=CHC1	СН3	осн ₃	0	N	·
597	-CH=CHC1	CH ₃	осн ₃	S	N	
598	-CC1=CHC1	CH ₃	OCH ₃	0	СН	
599	-CH=CC1 ₂	CH ₃	OCH ₃	0	N	
600	-CC1=CHC1	осн ₃	och ³	0	N	nden.
601	-сн ₂ -сн≐сн ₂	СН3	осн ₃	0	N	Smp. 146-147°
602	-CH ₂ -CH=CH ₂	осн ₃	OCH ³	3	N	

Nr.	A	R ₃	R ₄	х	E
650	-сн ₂ -сн=сн ₂	CH ₃	осн ₃	0	N
651	-сн ₂ -сн ₂ -осн ₃	CH ₃	осн ₃	0	N
652	-CC1=CH-C1	сн ₃	OCH ₃	0	Ŋ
653	-сн ₂ -осн ₃	CH ₃	OCH ₃	0	N
654	-CH ₂ -CH=CH-CH ₃	осн ₃	осн ₃	0	N
655	-CH ₂ -C(CH ₃)=CH ₂	CH ₃	OCH ₃	0	СН

Tabelle 6:

Nr.	A	Stellung von-X-A	R ₁	R ₂	X	E
701	-сн ₂ -сн=сн ₂	5	2-CH ₃	н	. 0	N
702	-сн ₂ -сн=сн ₂	5	2-CH ₃	н	0	СН
703	CH ₃ -CH ₃ -C=CH ₂	5	2-CH ₃	н	0	СН
704	СН ₃ -СН ₃ -С=СН ₂	5	2-CH ₃	H	0	N
705	-сн ₂ -сн=сн-сн ₃	5	2-CH ₃	н	0	N
706	-сн ₂ -сн=сн-сн ₃	5	2-CH ₃	н	0	СН
707	C1 -CH ₂ -C=CH ₂	5	2-CH ₃	н	0	СН
708	C1 -CH ₂ -C=CH ₂	5	2-CH ₃	н	0	N
709	-сн ₂ -сн=сн ₂	5	2-C1	Н	0	N
710	-CH ₂ -CH=CH ₂	5	2-C1	H	0	СН
711	C1 -CH ₂ -C=CH ₂	5	2-C1	н	0	СН
	C1 -CH ₂ -C=CH ₂	5	2-C1	н	0	N
713	CH ₃ -CH ₂ -C=CH ₂	5	2-C1	н	0	N
714	CH3 -CH2-C=CH2	5	2-C1	н	0	СН
715	-сн ₂ -о-сн ₃	5	2-C1	н	0	СН
716	-сн ₂ -о-сн ₃	5	2-C1	н	0	N

<u>Tabelle 6</u>: (Fortsetzung)

Nr.	A	Stellung von-X-A	R ₁	R ₂	x	E
717	-CH ₂ -S-CH ₃	5	2-C1	Н	0	N
718	-сн ₂ -s-сн ₃	5	2-C1	н	0	СН
719	-сн ₂ -сн=сн-сн ₃	5	2-C1	н	0	СН
720	-сн ₂ -сн=сн-сн ₃	5	2-C1	Н	0	N
721	-сн ₂ -сн ₂ -осн ₃	5	2-C1	H	0	N
722	-сн ₂ -сн ₂ -осн ₃	5	2-C1	H	0	СН
723	-сн ₂ -ос ₂ н ₅	5	2-C1	H	0	N
724	-сн ₂ -ос ₂ н ₅	5	2-C1	н	0	CH
725	-сн ₂ -сн ₂ -sсн ₃	5	2-C1	Ħ	0	СН
726	-CH ₂ -CH ₂ -SCH ₃	5	2-C1	Н	0	N
727	-сн ₂ -сн=сн ₂	. 3	2-CH ₃	H	0	N
728	-CH ₂ -CH=CH ₂	3	2-CH ₃	н	0	СН
729	CH ₃ -CH ₂ -C=CH ₃	3	2-CH ₃	н	0	СН
730	СН ₂ -С=СН ₃	3	2-CH ₃	н	0	N
731	-CH ₂ -CH=CH ₂	3	2-OCH ₃	н	0	N
732	-cH ₂ -CH=CH ₂	3	2-0CH ₃	н	0	СН
733	СН ₃ -СН ₂ -С=СН ₂	3	2-осн ₃	н	0	СН
734	-сн ₂ -с=сн ₂	3	2-0CH ₃	н	0	N
735	С1 -сн ₂ -с=сн ₂	3	2-0CH ₃	н	0	N
736	C1 -CH ₂ -C=CH ₂	3	2-0CH ₃	Н	0	СН

Tabelle 6: (Fortsetzung)

-		 					
Nr.	A	Stellung von-X-A	R ₁	R ₂	x	E	phys. Daten
737	-сн ₂ -сн=сн-сн ₃	3	2-0CH ₃	Н	0	Сн	
738	-сн ₂ -сн=сн-сн ₃	3	2-осн ₃	Н	0	N	
739	-сн ₂ -сн=сн ₂	5	2-0CH ₃	Н	0	N	
740	-CH ₂ -CH=CH ₂	5	2-0CH ₃	н	0	СН	
741	СН ₃ -СН ₂ -С=СН ₂	5	2-0CH ₃	н	0	СН	
742	CH ₃ -CH ₂ -C=CH ₂	5	2-OCH ₃	н	0	N	
743	-сн ₂ -сн=сн-сн ₃	. 5	2-0CH ₃	н	0	N	
744	-сн ₂ -сн=сн-сн ₃	5	2-осн ₃	н	0	СН	
745	C1 -CH ₂ -C=CH ₂	5	2-0CH ₃	н	0	СН	
746	C1 -CH ₂ -C=CH ₂	5	2-0CH ₃	н	0	N	
747	-CH ₂ -CH=CH ₂	3	5-Br	2-осн ₃	0	N	Smp. 258-259°
748	-CH ₂ -CH=CH ₂	3	5-Br	2-0CH ₃	0	СН	
749	CH ₃ -CH ₂ -C=CH ₂	3	5-Br	2-0CH ₃	0	СН	
750	CH ₃ -CH ₂ -C=CH ₂	3	5-Br	2-0CH ₃	0	N	
751	-CH ₂ -CH=CH ₂	3	5-COOCH ₃	2-0CH ₃	0	N	
752	-CH ₂ -CH=CH ₂	3	5-COOCH ₃	2-0CH ₃	0 ;	Сн	,
753	СН ₃ -СН ₂ -С=СН ₂	3	5-соосн ₃	2-0CH ₃	0	СН	
754	CH ₃ -CH ₂ -C=CH ₂	3	5-соосн ₃	2-осн ₃	0	N	

Tabelle 6: (Fortsetzung)

Nr.	A	Stellung von-X-A	R ₁	R ₂	X	E
755	-CH ₂ -CH=CH-CH ₃	3	5-COOCH ₃	2-0CH ₃	. 0	N
756	-сн ₂ -сн-сн-сн ₃	3	5-соосн ₃	2-осн ₃	0	СН
757	-сн ₂ -сн=сн ₂	2	5-NO ₂	3-CF ₃	0	N
758	-сн ₂ -сн=сн ₂	2	5-NO ₂	3-CF ₃	0	СН
759	-CH ₂ -CH=CH ₂	2	5-NO ₂	3-C1	0	СН
760	-CH ₂ -CH=CH ₂	2	5-NO ₂	3-C1	0	N
761	сн ₃ -сн-с=сн ₂	2	5-NO ₂	3-C1	0	N
762	сн ₃ -сн-с=сн ₂	2	5-no ₂	3-C1	0	CH
763	-сн ₂ -сн=сн ₂	2	5-CF ₃	3-NO ₂	0	СН
764	-сн ₂ -сн=сн ₂	2	5-CF ₃	3-NO ₂	0	N
765	-сн ₂ -сн=сн ₂	2	5-CH ₃	3-CH ₃	0	N
766	-сн ₂ -сн=сн ₂	2	5-CH ₃	3-CH ₃	0	СН
767	-сн ₂ -сн=сн-сн ₃	2	5-CH ₃	3-CH ₃	0	СН
768	-сн ₂ -сн=сн-сн ₃	2	5-CH ₃	3-CH ₃	0	N
769	-сн ₂ -сн=сн-сн ₃	2	5-C1	3-NO ₂	0	N
770	-сн ₂ -сн-сн ₃	2	5-C1	3-NO ₂	0	СН
771	-CH ₂ -CH=CH ₂	2	5-C1	3-NO ₂	0	СН
772	-сн ₂ -сн=сн ₂	2	5-C1	3-NO ₂	0	N
773	-сн ₂ -сн=сн ₂	2	5-C1	3-C1	0	N
774	-CH ₂ -CH=CH ₂	2	5-C1	3-C1	0	СН
775	-сн ₂ -сн ₂ -осн ₃	2	5-C1	3 - C1	0	СН
776	-сн ₂ -сн ₂ -осн ₃	2	5-C1	3-C1	0	N

Tabelle 6: (Fortsetzung)

Nr.	A	Stellung von-X-A	R ₁ .	R ₂	х	Е
777	-сн ₂ -осн ₃	2	5-C1	3-C1	0	N
778	-сн ₂ -осн ₃	2	5-C1	3-C1	Ö	СН
779	СH ₂ - С=СH ₂	2	5-C1	3-C1	0	СН
780	-CH ₂ -C=CH ₂	2	5-C1	3-C1	0	N
781	-CH ₂ -CH=CH ₂	2	5-Br	3-0CH ₃	0	N
782	-СH ₂ -СH=СH ₂	2	5-Br	3-осн ₃	0	СН
783	-CH ₂ -CH=CH ₂	3	5-Br	2-0CH ₃	0	СН
784	-CH ₂ -CH=CH ₂	3	5-Br	2-осн ₃	0	N
785	-сн ₂ -сн=сн ₂	2	5-coocH ₃	3-0CH ₃	0	N
786	-СH ₂ -СH=СН ₂	2	5-соосн ₃	3-0CH ₃	0	СН
787	-сн ₂ -сн=сн ₂	3	5-cooch ₃	2-0CH ₃	0	СН
788	-CH ₂ -CH=CH ₂	3	5-COOCH ₃	2-0CH ₃	0	N
789	Сн ₃ -сн ₂ -с=сн ₂	3	5-соосн ₃	2-0CH ₃	0	N
790	СН ₃ -СН ₂ -С=СН ₂	3	5-cooch ₃	2-0CH ₃	0	CH
791	-CH ₂ -CH=CH ₂	2	5-CH ₃	3-Br	0	СН
792	-CH ₂ -CH=CH ₂	2	5-CH ₃	3-Br	0	N
793	-CH ₂ -OCH ₃	2	5-CH ₃	3-Br	0	N
794	-сн ₂ -осн ₃	2	5-CH ₃	3-Br	0	CH
795	-CH ₂ -CH=CH ₂	2	5-Br	3-NO ₂	0	N
796	-CH ₂ -CH=CH ₂	2	5-Br	3-NO ₂	0	СН
797	-СH ₂ -СH=СH ₂	2	5-C1	3-Br	0	Сн

	Rabelle 6: (Fortsetzung)					-		
	«	Stellung von-X-A	R ₁	$^{R}_{2}$	×	ы	pnystkatische bacen	-
-CII ₂	-cu ₂ -ch=cll ₂	2	5-C1	3-Br	0	z	Smp. 175°	
-CH ₂	сн ₂ -с=сн ₂	2	5-61	3-Br	0	z		
HQ-	сн ₂ -с=сн ₂	2	5-61	3-Br	0	Cil		
F	-cH ₂ -CH ₂ -0-CH ₃	2	5-61	3-Br	0	CH		
두	-cH ₂ -CH ₂ -0-CH ₃	2	5-61	3-Br	0	Z		
Ş	-сн ₂ -о-сн ₃	5	2-NO ₂	=	0	5		
7	-сн ₂ -о-сн ₃	3	н	н	S	ES		
구	-cH ₂ -CH ₂ -OCH ₃	2	5-0C ₂ H ₄ -00H ₃	¥	0	Z		
节	-cH ₂ -CH=CH ₂	2	5-0CH ₂ -CII=CH ₂	Н	0	Z		
P	-CH ₂ -OCH ₃	2	5-0CH ₂ -0CH ₃	×	0	z		
Ÿ	-CH ₂ -CH ₂ -OCH ₃	2	5-S-C ₂ H ₄ -0CH ₃	#	တ	z		
Ÿ	-cu ₂ -scu ₃	2	5-S-C112-SCH3	=	တ	Z		
ᄗ	-сн ₂ so-сн ₃	2	5-S-CH ₂ -SOCH ₃	Ħ	တ	z		
811 -C	-CH ₂ -SO ₂ -CH ₃	2	5-CH ₂ -SO ₂ -CH ₃	Е	ಌೲ	Z		
				•				

Formulierungsbeispiele

Beispiel 4:

Formulierungsbeispiele für flüssige Wirkstoffe der Formel I (% = Gewichtsprozent)

a)	Emulsionskonzentrate	a)	ъ)	c)
	Wirkstoff	20%	10%	1%
	Ca-Dodecylbenzolsulfonat	5%	4%	2%
	Ricinusöl-polyäthylenglykoläther (36 Mol AeO)	5%	4%	4%
	Cyclohexanon	30%	20%	_
	Xylolgemisch	40%	62%	93%

Aus solchen Konzentraten können durch Verdünnen mit Wasser Emulsionen jeder gewünschten Konzentration hergestellt werden.

ъ)	Lösungen	a)	ъ)	c)	d)
	Wirkstoff	20%	10%	5%	17
	Aethylenglykol-monomethyl-äther	30%	-	50%	50%
	Polyäthylenglykol M G 400	_	70%	_	20%
	N-Methyl-2-pyrrolidon	50%	20%	44%	28%
	Epoxidiertes Kokosnussöl	_	_	1%	12

Die Lösungen sind zur Anwendung in Form kleinster Tropfen geeignet.

c)	Granulate	a)	ъ)
	Wirkstoff	5%	10%
	Kaolin	94%	_
	Hochdisperse Kieselsäure	17	-
	Attapulgit	-	907

Der Wirkstoff wird in Methylenchlorid gelöst, auf den Träger aufgesprüht und das Lösungsmittel anschliessend im Vakuum abgedampft.

. . .

d)	Stäubemittel	a)	ь)
	Wirkstoff	91%	12
	Hochdisperse Kieselsäure	17	5 %
	Talkum	98,9%	-
	Kaolin	-	947

Durch inniges Vermischen der Trägerstoffe mit dem Wirkstoff erhält man gebrauchsfertige Stäubemittel.

Beispiel 5:
Formulierungsbeispiele für feste Wirkstoffe der Formel I
(% = Gewichtsprozent)

a)	Spritzpulver	a)	ъ)	c)
	Wirkstoff	20%	60%	0,5%
	Na-Ligninsulfonat	5%	5%	5%
	Na-Laurylsulfat	3%	-	-
	Na-Diisobutylnaphthalinsulfonat		6%	6%
	Octylphenolpolyäthylenglykoläther 7-8 Mol AeO)	_	2%	2%
	Hochdisperse Kieselsäure	5%	27%	27%
	Kaolin	67%	-	_
٠	Natriumchlorid	_	-	59,5%

Der Wirkstoff wird mit den Zusatzstoffen gut vermischt und in einer geeignete Mühle gut vermahlen. Man erhält Spritzpulver, die sich mit Wasser zu Suspensionen jeden gewünschten Konzentration verdünnen lassen.

ъ)	Emulsions-Konzentrat	a)	ъ)
	Wirkstoff	10%	17
	Octylphenolpolyäthylenglykolähter (4-5 Mol AeO)	3%	37
	Ca-Dodecylbenzolsulfonat	3%	3%
	Ricinusölpolyglykoläther (36 Mol AeO)	4%	4%
	Cyclohexanon	30%	10%
	Xylolgemisch	50%	79%

Aus diesem Konzentrat können durch Verdünnen mit Wasser Emulsionen jeden gewünschten Konzentration hergestellt werden.

c)	<u>Stäubemittel</u>	a)	ъ)
	Wirkstoff	0,1%	17
	Talkum	99,9%	-
	Kaolin	` <u>-</u>	99%

Man erhält anwendungsfertige Stäubemittel, indem der Wirkstoff mit dem Träger vermischt und auf einer geeigneten Mühle vermahlen wird.

d)	Extruder Granulat	a)	ъ)
	Wirkstoff	10%	17
	Na-Ligninsulfonat	2%	27
	Carboxymethylcellulsoe	17	17
	Kaolin	87%	96%

Der Wirkstoff wird mit den Zusatzstoffen vermischt, vermahlen und mit Wasser angefeuchtet. Dieses Gemisch wird extrudiert und anschliessend im Luftstrom getrocknet.

e) Umhüllungs-Granulat Wirkstoff 3% Polyäthylenglykol (MG 200) 3% Kaolin 94%

Der fein gemahlene Wirkstoff wird in einem Mischer auf das mit Polyäthylenglykol angefeuchtete Kaolin gleichmässig aufgetragen. Auf diese Weise erhält man staubfreie Umhüllungs-Granulate.

f)	Suspensions- Konzentrat	a)		ъ)
	Wirkstoff	40%		5 %
-	Aethylenglykol	10%	. 1	.0%
	Nonylphenolpolyäthylenglykoläther (15 Mol AeO)	6%		17

Na-Ligninsulfonat	10%	5%
Carboxymethylcellulose	17	17
37%-ige wässrige Formaldehyd-Lösung	0,2%	0,27
Silikonöl in Form einer 75%-igen wässri-	-	
gen Emulsion	0,8%	0,8%
Wasser	32%	77%

Der fein gemahlene Wirkstoff wird mit den Zusatzstoffen innig vermischt. Man erhält so ein Suspensions-Konzentrat, aus welchem durch Verdünnen mit Wasser Suspensionen jeder gewünschten Konzentration hergestellt werden können.

g) Salzlösung

Wirkstoff	5%
Isopropylamin	1%
Octylphenolpolyäthylenglykol-	
äther (7-8 Mol AeO)	3%
Wasser	91%

Biologische Beispiele

Beispiel 6: Nachweis der Herbizidwirkung vor dem Auflaufen der Pflanzen

Im Gewächshaus werden Pflanzensamen in Blumentöpfen von 12-15 cm Durchmesser gesät. Unmittelbar danach wird die Erdoberfläche mit einer wässrigen Dispersion oder Lösung der Wirkstoffe behandelt. Es werden verschiedene Konzentrationen mit Wirkstoffmengen pro Hextar angewendet. Die Töpfe werden dann im Gewächshaus bei einer Temperatur von 22-25°C und 50-70% relative Luftfeuchtigkeit gehalten. Nach 3 Wochen wird der Versuch ausgewertet und die Wirkung nach folgendem Massstab beurteilt:

- 1: Pflanzen nicht gekeimt oder total abgestorben,
- 2-3: sehr starke Wirkung,
- 4-6: mittlere Wirkung,
- 7-8: geringe Wirkung,
- 9: keine Wirkung (wie unbehandelte Kontrolle).

Versuchsergebnisse (preemergent):

Wirkung Aufwandmenge kg AS/ha	Verb.	Nr.	601	
Testpflanze	0,25	0,12	0,06	0,03
Weizen	4	7	9	9
Avena fatua	2	2	3	4
Alopecurus myos.	2	2	2	2
Echinochloa c. g.	2	2	2	2
Rottboellia ex.	2	3	3	3
Cyperus escul.	3	3	3	3
Baumwolle	2	· 2	2	3
Abutilon	1	1	2	2
Xanthium Sp.	. 2	3	3	3
Chenopodium Sp.	1	1	2	2
Ipomoea	. 2	Ż	2	2
Sinapis	2	2	2	2
Galium aparine	2	2	2	3
Viola tricolor	2	2	2	2

Beispiel 7: Nachweis der Herbizidwirkung nach dem Auflaufen der Pflanzen (Kontaktwirkung)

Eine Anzahl Unkräuter und Kulturpflanzen, sowohl monocotyle wie dicotyle, wurden nach dem Auflaufen, im 4- bis 6-Blattstadium mit einer wässrigen Wirkstoffdispersion in verschiedenen Dosierungen gespritzt und dann bei 24° bis 26°C und 45-60% relativer Luftfeuchtigkeit gehalten. 15 Tage nach der Behandlung wird der Versuch ausgewertet und die Wirkung nach dem gleichen Massstab wie im Beispiel 6 bewertet.

Versuchsergebnisse (postemergent):

Wirkung Aufwandmenge kg/AS/ha	Verb. Nr. 601			
Testpflanze	0,25	0,12	0,06	0,03
Weizen	7	9	9	9
Mais	3	4	7	9
Reis trocken	4	5	8	9
Avena fatua	4	5	8	9
Alopecurus myos.	1	2	2	2
Echinochloa c. g.	2	2	6	6
Cyperus escul.	4	5	9	9
Baumwolle	4	6	7	9
Abutilon	2	2	2	2
Xanthium Sp.	1	1	1	1
Chenopodium Sp.	1	2	2	2
Ipomoea	2	3	3	4
Sinapis	1	1	1	1
Galium aparine	1	2	2	2 -
Viola tricolor	. 2	2	2	2

Beispiel 8: Nachweis der Keimhemmung an Lagerkartoffeln.

Eine Anzahl im Handel erhältliche Kartoffeln der Sorte "Urgenta" ohne Keime werden gewaschen und abgetrocknet. Danach werden die Kartoffeln für jeweils eine Minute in Wirkstoffemulsionen verschiedener Konzentration getaucht, in Kunststoffschalen auf Filterpapier ausgelegt und bei Temperaturen von 14° und 21°C im Dunkeln bei 50% relativer Luftfeuchtigkeit gehalten. Die Auswertung erfolgte 34 Tage nach der Applikation Gleichzeitig wird der Gewichtsverlust der Knollen und das

Gewicht der Keime im Vergleich zur unbehandelten Kontrolle ermittelt. Einige der Verbindungen der Forme I zeigten in diesem Versuch eine vollständige Verhinderung der Keimbildung. Gleichzeitig betrug der Gewichtsverlust der Kartoffeln weniger als 10% des Gewichtsverlustes der Kontrollkartoffeln.

Beispiel 9: Nachweis der Wuchshemmung bei tropischen Bodenbedeckern-Leguminosen (cover crops).

Die Versuchspflanzen (centrosema plumieri und centrosema pubescens) werden bis zum ausgewachsenen Stadium herangezogen und bis auf eine Höhe von 60 cm zurückgeschnitten. Nach 7 Tagen wird der Wirkstoff als wässrige Emulsion gespritzt. Die Versuchspflanzen werden bei 70% relativer Luftfeuchtigkeit und 6000 lux Kunstlicht, pro Tag 14 Stunden, bei Temperaturen von 27° bei Tag und 21°C bei Nacht gehalten.

4 Wochen nach der Applikation wird der Versuch ausgewertet. Es werden daber der Neuzuwachs im Vergleich zur Kontrolle abgeschätzt und gewochen und die Phytotoxizität bewertet.

In diesem Versuch zeigen die mit einigen der Wirkstoffe der Formel I behandelten Pflanzen eine deutliche Reduktion des Neuzuwachses (weniger als 20%) ohne dass dabei die Versuchspflanzen geschädigt wurden.

Patentansprüche

1. N-Phenylsulfonyl-N'-diazinyl- und triazinyl-harnstoffe der allgemeinen Formel I

worin

- A einen durch C_1 - C_4 -Alkoxy, C_1 - C_4 -Alkylthio, C_1 - C_4 -Alkylsulfinyl, C_1 - C_4 -Alkylsulfonyl, C_1 - C_4 -Halogenalkoxy, C_1 - C_4 -Halogenalkylthio, C_1 - C_4 -Halogenalkylsulfinyl oder C_1 - C_4 -Halogenalkylsulfonyl substituierten C_1 - C_6 -Alkylrest oder einen gegebenenfalls durch die aufgezählten Substituenten substituierten C_2 - C_6 -Alkenylrest oder einen C_2 - C_6 -Halogenalkenylrest,
- E die Methingruppe oder Stickstoff,
- X Sauerstoff, Schwefel, eine Sulfinyl- oder Sulfonylbrücke,
- Z Sauerstoff oder Schwefel,
- m die Zahl eins oder zwei
- R₁ Wasserstoff, Halogen, C₁-C₅-Alkyl, C₂-C₅-Alkenyl oder einen Rest -Y-R₅,
- R_2 Wasserstoff, Halogen, C_1 - C_5 -Alkyl, C_2 - C_5 -Alkenyl, C_1 - C_4 -Halogenalkyl, oder einen Rest -Y- R_5 , -COOR₆, -NO₂ oder -CO-NR₇R₈,
- R₃ und R₄ unabhängig voneinander Wasserstoff, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Alkylthio, C₁-C₄-Halogenalkyl, Halogen oder Alkoxy-alkyl mit höchstens 4 Kohlenstoffatomen,
- R₅ und R₆ je C₁-C₅-Alkyl, C₂-C₅-Alkenyl oder C₂-C₆-Alkinyl,
- R₇ und R₈ unabhängig voneinander Wasserstoff, C₁-C₅-Alkyl, C₂-C₅-Alkenyl oder C₂-C₆-Alkinyl und
 - Y Sauerstoff, Schwefel, eine Sulfinyl- oder Sulfonylbrücke bedeuten, sowie die Salze dieser Verbindungen.

- 2. Verbindungen gemäss Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, dass Z Sauerstoff bedeutet.
- 3. Verbindungen gemäss Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, dass die Reste R_3 und R_4 zusammen nicht mehr als 4 Kohlenstoffatome enthalten.
- 4. Verbindungen gemäss Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, dass Z Sauerstoff und m die Zahl eins bedeuten.
- 5. Verbindungen gemäss Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, dass Z Sauerstoff und m die Zahl zwei bedeuten.
- 6. Verbindungen gemäss Anspruch 4, dadurch gekennzeichnet, dass der Rest -X-A in 2- oder 3-Position zur Sulfonylgruppe steht.
- 7. Verbindungen gemäss Anspruch 6, dadurch gekennzeichnet, dass der Rest -X-A in der 2-Position steht.
- 8. Verbindungen gemäss Anspruch 5, dadurch gekennzeichnet, dass die beiden Reste -X-A in 2- und in 5-Stellung zur Sulfonylgruppe stehen.
- 9. Verbindungen gemäss Anspruch 2, dadurch gekennzeichnet, dass nur ein Rest -X-A in der 2-Stellung zum Sulfonylrest vorhanden ist und die Reste R_3 und R_4 zusammen nicht mehr als 4 Kohlenstoffatome enthalten.
- 10. Verbindungen gemäss Anspruch 2, dadurch gekennzeichnet, dass zwei Reste -X-A in 2- und 5-Stellung zum Sulfonylrest vorhanden sind und die Reste R_3 und R_4 zusammen nicht mehr als 4 Kohlenstoffatome enthalten.

- 11. Verbindungen gemäss Anspruch 9, dadurch gekennzeichnet, dass R_1 Wasserstoff bedeutet, und der Rest R_2 in der 5- oder 6-Stellung zur Sulfonylgruppe steht.
- 12. Verbindungen gemäss Anspruch 11, dadurch gekennzeichnet, dass R₂ für Wasserstoff, Halogen, C₁-C₄-Alkoxy, Nitro oder -COOR₆ steht.
- 13. Verbindungen gemäss Anspruch 12, dadurch gekennzeichnet, dass R_2 Wasserstoff, Fluor, Nitro oder C_1 - C_4 -Alkoxy und R_3 und R_4 jeweils Wasserstoff, C_1 - C_4 -Alkyl, C_1 - C_4 -Alkoxy, C_1 - C_4 -Alkylthio, Halogen oder Alkoxyalkyl bedeuten, wobei R_3 und R_4 zusammen höchstens 4 Kohlenstoffatome enthalten.
- 14. Verbindungen gemäss Anspruch 13, dadurch gekennzeichnet, dass R₂ Wasserstoff und R₃ und R₄ jeweils C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Alkoxy, Methylthio, Halogen oder Alkoxyalkyl bedeuten.
- 15. Verbindungen gemäss Anspruch 14, dadurch gekennzeichnet, dass X für Sauerstoff oder Schwefel steht.
- 16. Verbindungen gemäss Anspruch 15, dadurch gekennzeichnet, dass A für C₂-C₈-Alkoxyalkyl, C₂-C₄-Halogenalkenyl oder C₂-C₆-Alkenyl steht.
- 17. Verbindungen gemäss Anspruch 16, dadurch gekennzeichnet, dass A für C₂-C₈-Alkoxyalkyl und R₃ und R₄ jeweils für Methyl, Aethyl, Chlor oder Methoxy stehen.
- 18. Verbindungen gemäss Anspruch 16, dadurch gekennzeichnet, dass A für C₂-C₆-Alkenyl und R₃ und R₄ jeweils für Methyl, Aethyl, Chlor oder Methoxy stehen.

- 19. Verbindungen gemäss Anspruch 16, dadurch gekennzeichnet, dass A für durch ein bis drei Halogenatome substituiertes Vinyl und R_3 und R_4 jeweils für Methyl, Aethyl, Chlor oder Methoxy stehen.
- 20. Verbindungen gemäss Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, dass Z Schwefel, X Sauerstoff oder Schwefel, R_3 und R_4 jeweils unabhängig voneinander $C_1^{-C_3}$ -Alkyl, $C_1^{-C_3}$ -Alkoxy oder $C_1^{-C_3}$ -Alkylthio mit zusammen höchstens 4 Kohlenstoffatomen bedeuten und A für $-CH_2$ - $CH=CH_2$, $-CH_2$ - $CH=CH-CH_3$, $-CH_2$ - $CH(CH_3)=CH_2$, Methoxyäthyl, Methoxymethyl oder -CCl=CHCl steht und der Rest -X-A die 2-Stellung besetzt und m die Zahl 1 bedeutet.
- 21. N-(2-Allyloxyphenylsulfonyl)-N'-(4-methoxy-6-methyl-1,3,5-triazin-2-yl)-harnstoff gemäss Anspruch 1.
- 22. Verfahren zur Herstellung der Verbindungen der Formel I, Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, dass man ein Phenylsulfonamid der Formel II

worin A, R₁, R₂, X und m die unter Formel I gegebene Bedeutung haben, in Gegenwart einer Base mit einem N-Pyrimidinyl- oder -Triazinyl--carbamat der Formel

$$\begin{array}{c}
Z \\
\parallel \\
-O-C-NH-\bullet \\
N=\bullet \\
R_4
\end{array}$$
(III)

worin E, R₃, R₄ und Z die unter Formel I gegebene Bedeutung haben, umsetzt und gegebenenfalls in ihre Salze überführt.

23. Verfahren zur Herstellung der Verbindungen der Formel I, Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, dass man eine Phenylsulfonylisocyanat oder -isothiocyanat der Formel IV

worin A, R_1 , R_2 , m, X und Z die unter Formel I gegebene Bedeutung haben, gegebenenfalls in Gegenwart einer Base, mit einem Amin der Formel V

$$H_2N - \underbrace{R_3}_{R_4}$$
 (V)

worin E, R₃ und R₄ die unter Formel I gegebene Bedeutung haben, umsetzt und gegebenenfalls in ihre Salze überführt.

24. Verfahren zur Herstellung der Verbindungen der Formel I, Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, dass man im Sulfonamide der oben angegebenen Formel II gegebenenfalls in Gegenwart einer Base mit einem Isocyanat oder Isothiocyanat der Formel VI

$$Z=C=N-\bullet R_{3}$$

$$R_{4}$$
(VI)

worin E, R₃, R₄ und Z die unter Formel I gegebenen Bedeutung haben, umsetzt und gegebenenfalls in ihre Salze überführt.

25. Verfahren zur Herstellung der Verbindungen der Formel I, Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, dass man N-Phenylsulfonylcarbamat der Formel VII

worin A, R₁, R₂, m und X die unter Formel I gegebene Bedeutung haben, mit einem Amin der oben angegebenen Formel V umsetzt.

- 26. Verfahren zur Herstellung von Salzen der Formel I gemäss einem der Ansprüche 22 bis 25, dadurch gekennzeichnet, dass man einen Sulfonylharnstoff der Formel I mit einem Amin, einem Alkalimetalloder Erdalkalimetallhydroxid oder einen quaternären Ammoniumbase umsetzt.
- 27. Phenylsulfonamide der Formel II

$$R_{1} \xrightarrow{\text{SO}_{2}-\text{NH}_{2}} (X-A)_{\text{m}}$$

$$(II)$$

worin A, R₁, R₂, m und X die unter Formel I in Anspruch 1 gegebene Bedeutung haben.

28. Phenylsulfonamide der Formel VIII

$$R_1 \xrightarrow{\text{SO}_2-\text{NH}_2} \text{(VIII)}$$

worin R_1 und R_2 die unter Formel I in Anspruch 1 gegebene Bedeutung haben und X für Sauerstoff oder Schwefel steht, mit der Massgabe, dass R_2 nicht Wasserstoff bedeutet und stets einer der Substituenten R_2 oder -X'-H in 2-Stellung zur Sulfonamidgruppe steht.

- 29. Ein herbizides und den Pflanzenwuchs hemmendes Mittel, dadurch gekennzeichnet, dass es neben Träger- und/oder anderen Zuschlagstoffen als Wirkstoff mindestens einen N-Phenylsulfonyl-N'-triazinyl- oder -pyrimidinyl-harnstoff der Formel I, Anspruch 1, enthält.
- 30. Die Verwendung der N-Phenylsulfonyl-N'-triazinyl- oder -pyrimidinyl-harnstoffe der Formel I, Anspruch 1, oder sie enthaltender Mittel zur Bekämpfung unerwünschten Pflanzenwachstums.
- 31. Die Verwendung der N-Phenylsulfonyl-N'-triazinyl- oder -pyrimidinyl-harnstoffe der Formel I, Anspruch 1, oder sie enthaltender Mittel zur Hemmung des Pflanzenwachstums.
- 32. Die Verwendung der N-Phenylsulfonyl-N'-triazinyl- oder -pyrimidinyl-harnstoffe der Formel I, oder sie enthaltender Mittel, gemäss Anspruch 30, zur selektiven pre- oder postemergenten Bekämpfung von Unkräutern in Nutzpflanzenkulturen.
- 33. Die Verwendung der N-Phenylsulfonyl-N'-triazinyl- oder -pyrimidinyl-harnstoffe der Formel I, oder sie enthaltender Mittel, gemäss
 Anspruch 31, zur Unterdrückung des Pflanzenwachstums über das 2-Blattstadium hinaus, dadurch gekennzeichnet, dass die Wirkstoffe preemergent angewendet werden.

THIS PAGE BLANK (USPTO)